

(19)日本国特許庁(J P)

(12) 公 開 特 許 公 報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平6-192199

(43)公開日 平成6年(1994)7月12日

(51)Int.Cl. ⁵	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 C 237/08		7106-4H		
A 6 1 K 31/16		9283-4C		
31/165	A A B	9283-4C		
31/17	A A P	9283-4C		
31/18		9283-4C		

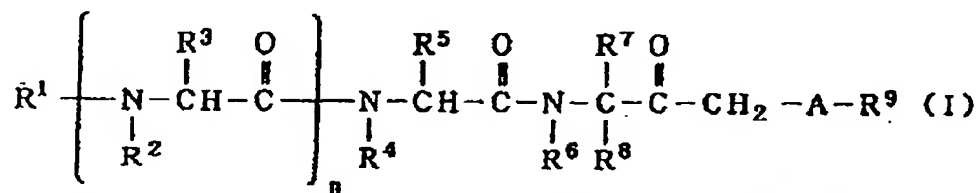
審査請求 未請求 請求項の数33(全 252 頁) 最終頁に続く

(21)出願番号	特願平4-359273	(71)出願人	000005968 三菱化成株式会社 東京都千代田区丸の内二丁目5番2号
(22)出願日	平成4年(1992)12月25日	(72)発明者	安藤 亮一 神奈川県横浜市緑区鴨志田町1000番地 三 菱化成株式会社総合研究所内
		(72)発明者	安藤 直子 神奈川県横浜市緑区鴨志田町1000番地 三 菱化成株式会社総合研究所内
		(72)発明者	増田 裕和 神奈川県横浜市緑区鴨志田町1000番地 三 菱化成株式会社総合研究所内
		(74)代理人	弁理士 長谷川 曉司
			最終頁に続く

(54)【発明の名称】 ケトン誘導体

(57)【要約】 (修正有)

下記一般式(I)



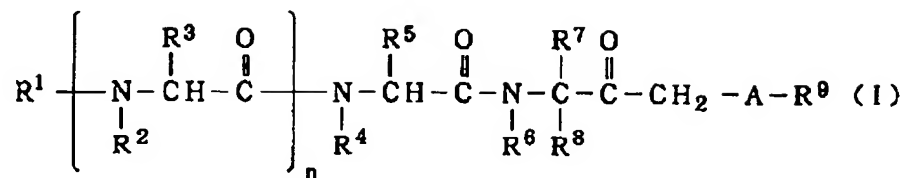
具体的には、例えば、(s)-3-((s)-2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノンで表されるケトン誘導体または薬学的に許容されるその塩およびそれを有効成分とする医薬組成物。

【効果】これらのケトン誘導体は、パパイン、カテプシンB、カテプシンH、カテプシンL、カルパイン等のチオールプロテアーゼに対して強い阻害活性を示し、また経口吸収性、組織移行性および細胞膜透過性にもすぐれており、医薬品として多様な用途が期待される。

【特許請求の範囲】

【化1】

【請求項1】 下記一般式（I）：



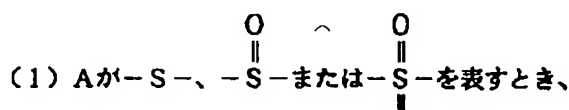
〔上記一般式（I）中、 R^1 は水素原子、 $R^{10}-\overset{O}{\parallel}C-$ 、 $R^{10}-O-\overset{O}{\parallel}C-$ 、



（ R^{10} は $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキル基、 $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルケニル基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基、置換基を有していてもよい $C_{10} \sim C_{14}$ の一部水素添加されたアリール基、フルオレニル基、置換基を有していてもよい複素環残基、 $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキルオキシ基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールオキシ基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ の一部水素添加されたアリールオキシ基、置換基を有していてもよい複素環オキシ基、置換基を有していてもよい $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルオキシ基および置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールチオ基から選ばれる1以上の置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基； $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキル基；置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基；置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ の一部水素添加されたアリール基；置換基を有していてもよい $C_2 \sim C_{10}$ のアルケニル基または置換基を有していてもよい複素環残基を表す。）を表し、 R^2 、 R^4 および R^6 はそれぞれ独立して水素原子または $C_1 \sim C_5$ のアルキル基を表し、 R^3 および R^5 はそれぞれ独立して水素原子、 $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルオキシ基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基、 $C_1 \sim C_{10}$ のアルコキシ基または

置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基を表す。また R^2 と R^3 、 R^4 と R^5 はそれぞれ一緒になって置換基を有していてもよい含窒素複素環を形成してもよい。 R^7 は $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキル基、ヒドロキシ基、複素環残基で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ のアルコキシ基、 $C_6 \sim C_{14}$ のアリールオキシ基、 $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルオキシ基、複素環残基で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ のアルキルチオ基、 $C_6 \sim C_{14}$ のアリールチオ基、 $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルチオ基、カルボキシ基、カルバモイル基、 $C_2 \sim C_6$ のアルコシカルボニル基、複素環残基および置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基から選ばれる1以上の置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基；水素原子； $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルオキシ基；置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基または $C_1 \sim C_{10}$ のアルコキシ基を表し、 R^8 は水素原子、 $C_1 \sim C_5$ のアルキル基または置換基を有していてもよい $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキル基を表すか、 R^7 と R^8 が一緒になって置換基を有していてもよいベンジリデン基または $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキル基を表す。

【化2】



R^9 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基または $-(CH_2)_m-X$ （ X は水素原子、ヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_5$ のアルキルチオ基、 $C_2 \sim C_6$ のアルコシカルボニルアミノ基、置換基を有していてもよい複素環残基、アミノ基、 $C_1 \sim C_5$ のモノアルキルアミノ基、 $C_2 \sim C_{10}$ のジアルキルアミノ基、 $C_2 \sim C_6$ のアシルアミノ基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_5$ のアルコキシ基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基または置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリー

ルオキシ基を表し、 m は0または1～15の整数を表す。）を表す。但し、 R^1 がベンジルオキシカルボニル基を表し、 R^4 、 R^6 及び R^8 がともに水素原子を表し、 R^5 がベンジル基を表し、 R^7 がメチル基を表し、かつ n が0を表すとき、 $-A-R^9$ はメチルチオ基を表さない。

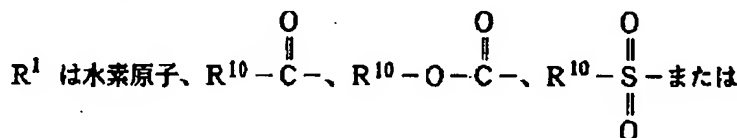
(2) A が $-O-$ を表すとき、 R^9 は水素原子または $-(CH_2)_1-X$ （ 1 は1～15の整数を表し、 X は前記定義に同じである。）を表す。

$$\begin{array}{c} \text{R}^{11} \\ | \\ \text{---} \end{array}$$

(3) A が ---N--- (R^{11} は水素原子または置換基を有していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ のアルキル基を表す。)を表すとき、 R^{11} は置換基を有していてもよい $\text{C}_6 \sim \text{C}_{14}$ のアリール基または $\text{---(CH}_2\text{)}_m\text{---X}$ (X および m は前記定義と同じである。)を表す。また R^9 と R^{11} は一緒になって、置換基を有していてもよい含窒素複素環を形成してもよい。また、 n は0または1を表す。)で表されるケトン誘導体または薬学的に許容されるその塩。

Aは-S-、 $\text{--}\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S--}$ 、 $\text{--}\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}\overset{\text{O}}{\parallel}\text{--}$ または $\text{--}\overset{\text{R}^{11}}{\text{N--}}$
(R¹¹)は置換基を有していてもよいC、 $\sim\text{C}_6$ 、 = のアルキ

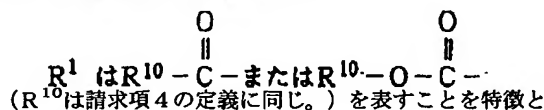
【化5】



～C₅ のアルキル基を表し、R⁵ は水素原子、置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基、C₁～C₁₀のアルコキシ基または置換基を有していてもよいC₁～C₁₅のアルキル基を表し、R⁷ はC₃～C₁₅のシクロアルキル基、ヒドロキシル基、複素環残基で置換されていてもよいC₁～C₅のアルコキシ基、C₆～C₁₄のアリールオキシ基、C₇～C₂₀のアラルキルオキシ基、複素環残基で置換されていてもよいC₁～C₅のアルキルチオ基、C₆～C₁₄のアリールチオ基、C₇～C₂₀のアラルキルチオ基、カルボキシル基、カルバモイル基、C₂～C₆のアルコキシカルボニル基および複素環残基置換基から選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁～C₁₅のアルキル基；水素原子；置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基または、C₁～C₁₀のアルコキシ基を表し、R⁸ は水素原子を表すことを特徴とする請求項3記載の化合物。

【化6】

【化7】



する請求項5記載の化合物。

【請求項7】 R^9 は $-(CH_2)_m-X$ (X は置換基を有していてもよい複素環残基を表す。)を表すことを特徴とする請求項6記載の化合物。

【請求項8】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とする医薬組成物。

【請求項9】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とするチオールプロテアーゼの異常亢進に起因する疾患のための医薬組成物。

【請求項10】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とする骨格筋の崩壊による疾患のための医薬組成物。

【請求項11】 骨格筋の崩壊による疾患がジストロフィーであることを特徴とする請求項10記載の医薬組成物。

【請求項12】 骨格筋の崩壊による疾患が筋萎縮症であることを特徴とする請求項10記載の医薬組成物。

【請求項13】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とする虚血性疾患のための医薬組成物。

【請求項14】 虚血性疾患が心筋梗塞であることを特徴とする請求項13記載の医薬組成物。

【請求項15】 虚血性疾患が脳卒中であることを特徴とする請求項13記載の医薬組成物。

【請求項16】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とするアルツハイマー病のための医薬組成物。

【請求項17】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とする頭部外傷に起因する意識障害または運動障害のための医薬組成物。

【請求項18】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とする神経細胞の脱髄に起因する疾患のための医薬組成物。

【請求項19】 神経細胞の脱髄に起因する疾患が多発硬化症であることを特徴とする請求項18記載の医薬組成物。

【請求項20】 神経細胞の脱髄に起因する疾患が末梢神経障害であることを特徴とする請求項18記載の医薬組成物。

【請求項21】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とする白内障のための医薬組成物。

【請求項22】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とする炎症のための医薬組成物。

【請求項23】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とするアレ

ギー性疾患のための医薬組成物。

【請求項24】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とする肝疾患のための医薬組成物。

【請求項25】 肝疾患が劇症肝炎であることを特徴とする請求項24記載の医薬組成物。

【請求項26】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とする骨粗鬆症のための医薬組成物。

【請求項27】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とする高カルシウム血症のための医薬組成物。

【請求項28】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とする性ホルモン受容体の異常活性化に起因する疾患のための医薬組成物。

【請求項29】 性ホルモン受容体の異常活性化に起因する疾患が乳ガンであることを特徴とする請求項28記載の医薬組成物。

【請求項30】 性ホルモン受容体の異常活性化に起因する疾患が前立腺ガンであることを特徴とする請求項28記載の医薬組成物。

【請求項31】 性ホルモン受容体の異常活性化に起因する疾患が前立腺肥大症であることを特徴とする請求項28記載の医薬組成物。

【請求項32】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とする癌の増殖抑制または転移予防のための医薬組成物。

【請求項33】 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなることを特徴とする血小板凝集抑制のための医薬組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】本発明は新規なケトン誘導体に関し、詳細にはパバイン、カテプシンB、カテプシンH、カテプシンL、カルパイン等のチオールプロテアーゼに対して強い阻害作用を示す新規なケトン誘導体に関する。

【0002】

【従来の技術および発明が解決しようとする課題】パバイン、カテプシンB、カテプシンH、カテプシンL、カルパイン等のチオールプロテアーゼの生体内での働きが解明されるに従い、その異常亢進が種々の疾患の原因であることが判明してきており、またチオールプロテアーゼ阻害剤がそれらの疾患の動物モデルで有効であったという報告が増えつつある。

【0003】筋ジストロフィー、筋萎縮症などの筋疾患で見られる骨格筋崩壊において、カルパインやカテプシンBなどのチオールプロテアーゼは、筋線維蛋白質の分解を通じてZ線の消失などの初期過程に関与していると

考えられている(代謝, 25巻, 183ページ, 1988年)。また、チオールプロテアーゼ阻害剤であるE-64-dは、筋ジストロフィー症ハムスターにおいて延命効果等の効果があったと報告されている(Journal of Pharmacobio Dynamics, 10巻, 678ページ, 1987年)。従って、チオールプロテアーゼ阻害剤は筋ジストロフィー、筋萎縮症等の治療薬になりうると考えられる。

【0004】心筋梗塞や脳卒中等の虚血性疾患において、虚血後の細胞障害の主な原因は、キサンチン酸化酵素が産生する活性酸素である。虚血の過程で上昇した Ca^{2+} 濃度によって活性化されたカルパインがキサンチン酸化酵素の前駆体であるキサンチン脱水素酵素を限定分解して酸化酵素に変換しているという説がある(New England Journal of Medicine, 312巻, 159ページ, 1985年)。また、カルパインの活性化が心筋細胞壊死や脳神経細胞死の直接的な原因にもなりうると考えられている(最新医学, 43巻, 783ページ, 1988年)。カルパイン阻害剤であるNCO-700が心筋梗塞の動物モデルで効果があることが報告されており(Arzneimittel Forschung/Drug Research, 36巻, 190ページ, 671ページ, 1986年)、またE-64-Cは脳虚血後の微小管結合蛋白の分解を抑制している(Brain Research, 526巻, 177ページ, 1990年)。従って、カルパインの阻害剤は、心筋梗塞や脳卒中などの虚血性疾患の治療薬になると考えられる。

【0005】アルツハイマー病脳に特有に見られる老人斑には、アミロイドという蛋白が沈着しているが、このアミロイドはアミロイド蛋白前駆体(APP)の分解により生成することが知られている。APPの正常代謝ではアミロイドは生成しないが、異常亢進したプロテアーゼによる異常代謝によりアミロイドが生成し、これが老人斑になると考えられている(Scientific American, 1991年11月号, 40ページ)。従って、プロテアーゼの阻害剤は、アルツハイマー病の治療薬になると期待されている。

【0006】うさぎの頭部外傷モデルにおいて、カルパインが活性化されていることが報告されており(Neurochemical Research, 16巻, 483ページ, 1991年)、またラットの頭部外傷モデルにおいて、カルパイン阻害剤であるロイペプチンを投与することにより、軸索の保護作用が観察されている(Journal of Neurosurgery, 65巻, 92ページ, 1986年)。従って、カルパイン阻害剤は、頭部外傷において意識障害改善や運動障害改善等の効果があると考えられる。

【0007】神経細胞の樹状突起に存在するミエリン結合蛋白がカルパインにより分解されるという報告がある

(Journal of Neurochemistry, 47巻, 1007ページ, 1986年)。従って、カルパイン阻害剤が神経細胞の脱髄によって起こるとされる疾患、例えば多発性硬化症や末梢神経のニューロパシーに対して効果があると考えられる。

【0008】白内障のうちの多くのものは、水晶体中の水溶性蛋白であるクリスタリンがプロテアーゼの働きにより加水分解されるために水晶体の白濁が生じると言われている。実験モデルの白内障及びヒトのある種の白内障では、水晶体内のカルシウム濃度が上昇しており(Investigative Ophthalmology & Visual Science, 28巻, 1702ページ, 1987年, Experimental Eye Research, 34巻, 413ページ, 1982年)、また水晶体中に含まれるプロテアーゼのうち最も多いのはカルパインであることから(Lens and Eye Toxicity Research, 6巻, 725ページ, 1989年)、カルパインの異常亢進が白内障の原因の一つであると考えられている。カルパインの阻害剤であるE-64が白内障の実験モデルで効果があったとの報告(Investigative Ophthalmology & Visual Science, 32巻, 533ページ, 1991年)もあることから、カルパイン阻害剤は白内障の治療薬になると考えられる。

【0009】炎症とのかかわりが深い好中球は、走化性因子やホルボールエステルによる刺激に対して脱顆粒やスーパーオキシドの産生で応答することが知られており、これはプロテインキナーゼC(PKC)によって媒介されていると考えられている。カルパインはこのPKCを活性化する働きをしており、脱顆粒には促進的に、スーパーオキシド産生には抑制的に作用しているという報告がある(Journal of Biological Chemistry, 263巻, 1915ページ, 1988年)。また、ラットのマクロファージにおけるカテプシンBの濃度が、白血球や好中球の場合よりも30~40倍高く、しかも炎症マクロファージの酵素濃度の方が普通のマクロファージより6倍高いと報告されている(Journal of Biochemistry, 98巻, 87ページ, 1985年)。これらのことから、チオールプロテアーゼの阻害剤は、抗炎症剤として用いることができると考えられている。

【0010】I型アレルギー反応は、生体が抗原に感作されることにより産生した免疫グロブリンE(IgE)を介して進行する。チオールプロテアーゼ阻害剤であるエスタチンAは、IgEの産生を特異的に抑制し、IgGの産生には影響を与えないと報告されている(The Journal of Antibiotics, 42巻, 1362ページ, 1989年)。従って、チオールプロテアーゼ阻害剤は、抗アレルギー剤として用いる

ことができると考えられる。

【0011】肝細胞が壊死する場合には、細胞膜の障害により Ca^{2+} の透過性が増して細胞内の Ca^{2+} 濃度が高まり、カルパインが活性化されるために、その基質である骨格蛋白等の分解が起きて細胞死に致ると考えられている。従ってカルパイン阻害剤は、劇症肝炎の治療として用いることができる。カテプシンB、カテプシンL等のカテプシン類は、破骨細胞内での骨コラーゲンの分解に関与している。副甲状腺ホルモンを投与して骨破壊を亢進させたラットに、カテプシン類の阻害剤であるE-64、あるいはエスタチンAを投与すると、血中カルシウム濃度及びヒドロキシプロリン濃度が低下することが報告されている(Biochemical and Biophysical Research Communication, 125巻, 441ページ, 1984年; 特開平2-218610号公報)。従って、カテプシン類の阻害剤は、骨粗鬆症、高カルシウム血症等の治療薬になると考えられる。

【0012】カルパインの基質として、エストロゲン受容体やアンドロゲン受容体等の性ホルモン受容体があり、カルパインはこれらの受容体を活性化させることが知られている。従って、カルパインの異常亢進は性ホルモン受容体の異常活性化によると考えられる疾患、例えば乳癌、前立腺癌、前立腺肥大をひきおこすと言われており、カルパインの阻害剤は上記の疾患の治療薬になると考えられる。

【0013】細胞の癌化に伴い、表皮増殖因子(EGF)受容体が活性化するとされており、カルパインはEGF受容体を基質としてこれを活性化することが知られている。また、成人T細胞性ヒト白血病ウィルス(ATLV/HTLV-1)に感染した細胞において、カルパインが活性化されていたとの報告がある(生化学, 57巻, 1202ページ, 1985年)。一方、カテプシンBが癌の転位の重要な段階であるコラーゲン分解を促進したり、あるいは直接コラーゲンを分解することや、新生物細胞の原形質膜と関係が深いことなどから、癌の転位プロセスに大きく関与していると言われていた(Tumor Progression and Markers, 47ページ, 1982年, Journal of Biological Chemistry, 256巻, 8536ページ, 1984年)。これらのことから、チオールプロテアーゼ阻害剤は、癌の増殖抑制、転位予防に効果があると考えられる。

【0014】血小板が活性化されると凝集を起こし、血栓の原因となる。カルパインの阻害剤であるE-64-dが、トロンビンで惹起される血小板凝集を抑制したとの報告がある(Thrombosis Research, 57巻, 847ページ, 1990年)。したがって、カルパインの阻害剤は、血小板凝集抑制剤として用いることができる。

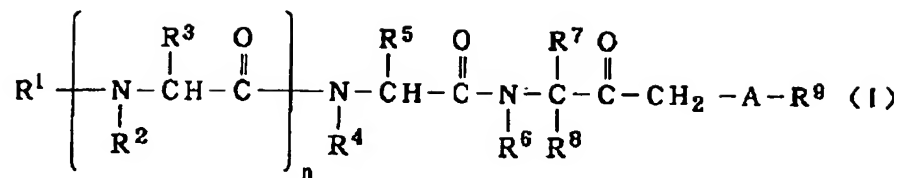
【0015】以上述べてきたように、チオールプロテアーゼの異常亢進は種々の疾患の原因となり、またいくつかのチオールプロテアーゼ阻害剤は動物モデルなどで有効だと報告されている。しかしながら、既知の阻害剤は、E-64 (Agricultural and Biological Chemistry, 42巻, 529ページ, 1978年)、E-64-d (Journal of Biochemistry, 93巻, 1305ページ, 1983年)、NCO-700 (特開昭58-126879号公報)、エスタチンA, B (The Journal of Antibiotics, 42巻, 1362ページ, 1989年)等のエポキシコハク酸誘導体あるいはペプチドのクロロメチルケトン(Journal of Biochemistry, 99巻, 173ページ, 1986年)やアシルオキシメチルケトン(Biochemistry, 30巻, 4678ページ, 1991年)に代表されるペプチドの α -置換ケトンなど、不可逆阻害剤がほとんどである。一般に不可逆阻害剤は、標的酵素以外の生体構成成分と非特異的に反応しやすいために、毒性が強いと言われており、臨床で用いられた化合物は少ない。また、可逆阻害剤としてはロイペプチン(The Journal of Antibiotics, 22巻, 183ページ, 1969年)、カルペプチン(Journal of Enzyme Inhibition, 3巻, 195ページ, 1990年)等のペプチジルアルデヒドが知られているが、化学的な安定性、生体内での安定性、細胞膜透過性などに問題があると言われている。

【0016】

【課題を解決するための手段】そこで本発明者らは、経口吸収性、組織移行性、細胞膜透過性にすぐれたチオールプロテアーゼの可逆阻害剤について研究を進めた結果、本発明を完成するに至った。すなわち、本発明の要旨は、下記一般式(I)

【0017】

【化8】



〔上記一般式 (I) 中、 R^1 は水素原子、 $R^{10}-\overset{O}{\parallel}C-$ 、 $R^{10}-O-\overset{O}{\parallel}C-$ 、

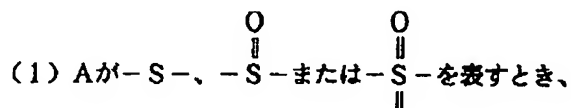


【0018】 (R^{10} は $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキル基、 $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルケニル基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基、置換基を有していてもよい $C_{10} \sim C_{14}$ の一部水素添加されたアリール基、フルオレニル基、置換基を有していてもよい複素環残基、 $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキルオキシ基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールオキシ基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ の一部水素添加されたアリールオキシ基、置換基を有していてもよい複素環オキシ基、置換基を有していてもよい $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルオキシ基および置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールチオ基から選ばれる1以上の置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基； $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキル基；置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基；置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ の一部水素添加されたアリール基；置換基を有していてもよい $C_2 \sim C_{10}$ のアルケニル基または置換基を有していてもよい複素環残基を表す。)を表し、 R^2 、 R^4 および R^6 はそれぞれ独立して水素原子または $C_1 \sim C_5$ のアルキル基を表し、 R^3 および R^5 はそれぞれ独立して水素原子、 $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルオキシ基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基、 $C_1 \sim C_{10}$ のアル

コキシ基または置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基を表す。また R^2 と R^3 、 R^4 と R^5 はそれぞれ一緒になって置換基を有していてもよい含窒素複素環を形成してもよい。 R^7 は $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキル基、ヒドロキシル基、複素環残基で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ のアルコキシ基、 $C_6 \sim C_{14}$ のアリールオキシ基、 $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルオキシ基、複素環残基で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ のアルキルチオ基、 $C_6 \sim C_{14}$ のアリールチオ基、 $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルチオ基、カルボキシル基、カルバモイル基、 $C_2 \sim C_6$ のアルコキシカルボニル基、複素環残基および置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基から選ばれる1以上の置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基；水素原子； $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルオキシ基；置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基または $C_1 \sim C_{10}$ のアルコキシ基を表し、 R^8 は水素原子、 $C_1 \sim C_5$ のアルキル基または置換基を有していてもよい $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキル基を表すか、 R^7 と R^8 が一緒になって置換基を有していてもよいベンジリデン基または $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキル基を表す。

【0019】

【化9】



【0020】 R^9 は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基または $-(CH_2)_m-X$ (X は水素原子、ヒドロキシル基、 $C_1 \sim C_5$ のアルキルチオ基、 $C_2 \sim C_6$ のアルコキシカルボニルアミノ基、置換基を有していてもよい複素環残基、アミノ基、 $C_1 \sim C_5$ のモノアルキルアミノ基、 $C_2 \sim C_{10}$ のジアルキルアミノ基、 $C_2 \sim C_6$ のアシルアミノ基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_5$ のアルコキシ基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基または置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールオキシ基を表し、 m は0または1～

15の整数を表す。)を表す。但し、 R^1 がベンジルオキシカルボニル基を表し、 R^4 、 R^6 及び R^8 がともに水素原子を表し、 R^5 がベンジル基を表し、 R^7 がメチル基を表し、かつ n が0を表すとき、 $-A-R^9$ はメチルチオ基を表さない。

【0021】 (2) A が $-O-$ を表すとき、 R^9 は水素原子または $-(CH_2)_1-X$ (1 は1～15の整数を表し、 X は前記定義に同じである。)を表す。

【0022】

【化10】

R¹¹

|

(3) A²⁰-N¹-(R¹¹は酸素原子または置換基を有しているもよいC₆~C₁₄のアリール基または(CH₂)_m-X (Xおよびmは前記定義に同じである。))を表す。またR⁹とR¹¹は一緒になって、置換基を有しているもよい含窒素複素環を形成してもよい。

【0023】また、nは0または1を表す。]で表されるケトン誘導体または薬学的に許容されるその塩およびこれを有効成分とする医薬組成物に存する。以下、本発明につき詳細に説明する。上記一般式(I)においてR¹⁰で定義されるC₁~C₂₀のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基、ヘキシル基、イソヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基、デシル基、ウンデシル基、ドデシル基、トリデシル基、テトラデシル基、ペンタデシル基、ヘキサデシル基、ヘプタデシル基、オクタデシル基、ノナデシル基、イコシル基等が挙げられ、かかるアルキル基はシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、シクロノニル基、シクロデシル基、シクロウンデシル基、シクロドデシル基、シクロトリデシル基、シクロテトラデシル基、シクロペンタデシル基等のC₃~C₁₅のシクロアルキル基；シクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、1,4-シクロヘキサジエニル基、シクロヘプテニル基、シクロオクテニル基、シクロデセニル基、シクロドデセニル基、シクロペンタデセニル基等のC₃~C₁₅のシクロアルケニル基；フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、アントリル基等のC₆~C₁₄のアリール基；1,2-ジヒドロナフチル基、1,2,3,4-テトラヒドロナフチル基等のC₁₀~C₁₄の一部水素添加されたアリール基；フルオレニル基；フラン環、ジヒドロフラン環、テトラヒドロフラン環、ピラン環、ジヒドロピラン環、テトラヒドロピラン環、ベンゾフラン環、ジヒドロベンゾフラン環、イソベンゾフラン環、クロメン環、クロマン環、イソクロマン環、チオフエン環、ベンゾチオフエン環、ピロール環、ピロリル環、ピロリジン環、イミダゾール環、イミダゾリン環、イミダゾリジン環、ピラゾール環、ピラゾリン環、ピラゾリジン環、トリアゾール環、テトラゾール環、ピリジン環、ピリジノキソイド環、ピペリジン環、ピラジン環、ピペラジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、インドリジン環、インドール環、インドリン環、イソインドール環、イソインドリン環、インダゾール環、ベンズイミダゾール環、プリン環、キノリジン環、キノリン環、フタラジン環、ナフチリジン環、キノキサリン

環、キナザリン環、シナザリン環、プテリジン環、オキサゾール環、オキサゾリジン環、イソオキサゾール環、イソキサゾリジン環、チアゾール環、チアゾリジン環、イソチアゾール環、イソチアゾリジン環、ジオキソラン環、ジオキサン環、ジチアン環、モルホリン環、チオモルホリン環等の酸素原子、硫黄原子、窒素原子から選ばれるヘテロ原子を1~4個有し、環を構成する総原子数が5~10の複素環残基；シクロプロピルオキシ基、シクロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロヘプチルオキシ基、シクロオクチルオキシ基、シクロデシルオキシ基、シクロドデシルオキシ基、シクロペンタデシルオキシ基等のC₃~C₁₅のシクロアルキルオキシ基；フェノキシ基、1-ナフチルオキシ基、2-ナフチルオキシ基等のC₆~C₁₄のアリールオキシ基；1,2,3,4-テトラヒドロ-1-ナフチルオキシ基、1,2,3,4-テトラヒドロ-2-ナフチルオキシ基、5,6,7,8-テトラヒドロ-1-ナフチルオキシ基、5,6,7,8-テトラヒドロ-2-ナフチルオキシ基等のC₆~C₁₄の一部水素添加されたアリールオキシ基；2-テトラヒドロフリルオキシ基、3-テトラヒドロフリルオキシ基、2-テトラヒドロピラニルオキシ基、3-テトラヒドロピラニルオキシ基、3-ピロリルオキシ基、1-ピペラジニルオキシ基、3-モルホリニルオキシ基、4-モルホリニルオキシ基、2-ピリジルオキシ基、3-ピリジルオキシ基、4-ピリジルオキシ基等の酸素原子、硫黄原子、窒素原子から選ばれるヘテロ原子を1~4個有し、環を構成する総原子数が5~10の複素環オキシ基；ベンジルオキシ基、1-フェニルエトキシ基、2-フェニルエトキシ基、1-フェニルプロポキシ基、2-フェニルプロポキシ基、3-フェニルプロポキシ基、4-フェニルプロポキシ基、5-フェニルペンチルオキシ基、1-ナフチルメトキシ基、2-ナフチルメトキシ基、1-(1-ナフチル)エトキシ基、2-(1-ナフチル)エトキシ基、1-(2-ナフチル)エトキシ基、2-(2-ナフチル)エトキシ基等のC₇~C₂₀のアラルキルオキシ基；およびフェニルチオ基、1-ナフチルチオ基、2-ナフチルチオ基等のC₆~C₁₄のアリールチオ基から選ばれる1以上の置換基を有しているもよい。またR¹⁰で定義されるC₃~C₁₅のシクロアルキル基、C₆~C₁₄のアリール基、C₆~C₁₄の一部水素添加されたアリール基および複素環残基としては上述の各置換基が挙げられ、C₂~C₁₀のアルケニル基としてはビニル基、1-プロペニル基、アリル基、イソプロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、1-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、1-ヘプテニル基、1-オクテニル基、1-ノネニル基、1-デセニル基等が挙げられる。かかるア

ルケニル基は、上述の $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキル基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基、置換基を有していてもよい複素環残基、 $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキルオキシ基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールオキシ基、置換基を有していてもよい複素環オキシ基、置換基を有していてもよい $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルオキシ基および置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールチオ基から選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。

【0024】 R^2 、 R^4 および R^5 において定義される $C_1 \sim C_5$ のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基等が挙げられる。 R^3 および R^5 において定義される置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基としては、 R^{10} で定義したものと同様の基が挙げられ、かかるアルキル基はフッ素原子、塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子； R^{10} で定義したものと同様の $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキル基；ヒドロキシル基； R^{10} で定義したものと同様の複素環残基で置換されていてもよいメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、tert-ペンチルオキシ基等の $C_1 \sim C_5$ のアルコキシ基； R^{10} で定義したものと同様の $C_6 \sim C_{14}$ のアリールオキシ基； R^{10} で定義したものと同様の $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルオキシ基；メルカプト基； R^{10} で定義したものと同様の複素環残基で置換されていてもよいメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、イソブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、ペンチルチオ基、イソペンチルチオ基等の $C_1 \sim C_5$ のアルキルチオ基； R^{10} で定義したものと同様の $C_6 \sim C_{14}$ のアリールチオ基；ベンジルチオ基、1-フェニルエチルチオ基、2-フェニルエチルチオ基、1-ナフチルメチルチオ基、2-ナフチルメチルチオ基等の $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルチオ基；カルボキシル基；カルバモイル基；メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基、イソペンチルオキシカルボニル基等の $C_2 \sim C_6$ のアルコキシカルボニル基； R^{10} で定義したものと同様の複素環残基；アミノ基；メチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基等の $C_1 \sim C_5$ のモノアルキルアミノ基；ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基等の $C_2 \sim C_{10}$ のジアルキルアミノ基；メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、プロポキシカルボ

ニルアミノ基、イソプロポキシカルボニルアミノ基、ブトキシカルボニルアミノ基、イソブトキシカルボニルアミノ基、tert-ブトキシカルボニルアミノ基、ペンチルオキシカルボニルアミノ基、イソペンチルオキシカルボニルアミノ基等の $C_2 \sim C_6$ のアルコキシカルボニルアミノ基；アセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、イソブチリルアミノ基、バレリルアミノ基、イソバレリルアミノ基等の $C_2 \sim C_6$ のアシルアミノ基；グアニジル基；オキソ基；およびフェニル基、トリル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、アントリル基等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基から選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。 $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルオキシ基、および $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基としては R^{10} で定義したものと同様の基が挙げられ、 $C_1 \sim C_{10}$ のアルコキシ基としてはメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、tert-ペンチルオキシ基、ヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基、ヘプチルオキシ基、オクチルオキシ基、デシルオキシ基等が挙げられる。

【0025】 R^2 と R^3 、 R^4 と R^5 が一緒になって形成する含窒素複素環としては、ピロリジン環、ピペリジン環、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環、1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン環、パーヒドロキノリン環、パーヒドロイソキノリン環等のヘテロ原子を1~4個有し、環を構成する総原子数が5~10のものが挙げられる。かかる複素環上には置換基が存在していてもよい。

【0026】 R^7 で定義される $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルオキシ基、および $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基としては R^{10} で定義したものと同様の基が挙げられ、 $C_1 \sim C_{10}$ のアルコキシ基としては R^3 および R^5 で定義したものと同様の基が挙げられる。置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基としては、 R^{10} で定義したものと同様の基が挙げられ、かかるアルキル基は R^{10} で定義したものと同様の $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキル基；ヒドロキシル基； R^{10} で定義したものと同様の複素環残基で置換されていてもよいメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、tert-ペンチルオキシ基等の $C_1 \sim C_5$ のアルコキシ基； R^{10} で定義したものと同様の $C_6 \sim C_{14}$ のアリールオキシ基； R^{10} で定義したものと同様の $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルオキシ基； R^{10} で定義したものと同様の複素環残基で置換されていてもよいメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、イソブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、ペンチルチオ基、イソペンチルチオ基等の $C_1 \sim C$

C_5 のアルキルチオ基; R^{10} で定義したものと同様の $C_6 \sim C_{14}$ のアリールチオ基; ベンジルチオ基、1-フェニルエチルチオ基、2-フェニルエチルチオ基、1-ナフチルメチルチオ基、2-ナフチルメチルチオ基等の $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルチオ基; カルボキシ基; カルバモイル基; メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基、イソペンチルオキシカルボニル基等の $C_2 \sim C_6$ のアルコキシカルボニル基; R^{10} で定義したものと同様の複素環残基; およびフェニル基、トリル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、アントリル基等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基から選ばれる1以上の置換基を有しているもよい。

【0027】 R^8 で表される $C_1 \sim C_5$ のアルキル基としては、 R^2 、 R^4 および R^6 において定義したものと同様の基が挙げられ、 $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキル基としてはベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、1-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、2-(1-ナフチル)エチル基、2-(2-ナフチル)エチル基等が挙げられる。

【0028】 R^7 と R^8 が一緒になって形成する $C_3 \sim C_{15}$ のシクロアルキル基としては、 R^{10} で定義したものと同様の基が挙げられる。 R^9 で定義される $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基としては、 R^{10} で定義したものと同様の基が挙げられる。 X で定義される $C_1 \sim C_5$ のアルキルチオ基、 $C_2 \sim C_6$ のアルコキシカルボニルアミノ基、 $C_1 \sim C_5$ のモノアルキルアミノ基、 $C_2 \sim C_{10}$ のジアルキルアミノ基、 $C_2 \sim C_6$ のアシルアミノ基、 $C_1 \sim C_5$ のアルコキシ基は R^3 および R^5 で $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基の置換基として定義したものと同様の基が挙げられ、複素環残基、 $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基、 $C_6 \sim C_{14}$ のアリールオキシ基としては R^{10} で定義したものと同様の基が挙げられる。

【0029】 R^{11} で定義される $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基としては、 R^{10} で定義したものと同様の基が挙げられ、かかるアルキル基はヒドロキシル基; メルカプト基; アミノ基; ベンジルチオ基、1-フェニルエチルチオ基、2-フェニルエチルチオ基、1-ナフチルメチルチオ基、2-ナフチルメチルチオ基等の $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキルチオ基; それぞれが R^3 または R^5 で $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基の置換基として定義したものと同様の $C_1 \sim C_5$ のアルコキシ基、 $C_1 \sim C_5$ のアルキルチオ基、 $C_1 \sim C_5$ のモノアルキルアミノ基、 $C_2 \sim C_{10}$ のジアルキルアミノ基; それぞれが R^{10} で定義したものと同様の $C_6 \sim C_{14}$ のアリールオキシ基、 $C_7 \sim C_{20}$ のアラルキ

ルオキシ基、 $C_6 \sim C_{14}$ のアリールチオ基、複素環残基から選ばれる1以上の置換基を有しているもよい。

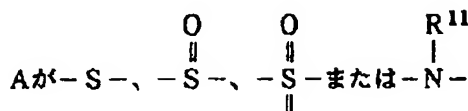
【0030】 また、 R^9 と R^{11} が一緒になって形成する含窒素複素環としては、ピロリジン環、ピペリジン環、ピペラジン環、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環、1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン環、パーヒドロキノリン環、パーヒドロイソキノリン環等のヘテロ原子を1~4個有し、環を構成する総原子数が5~10のものが挙げられる。かかる複素環上には置換基が存在しているもよい。

【0031】 更に上記の定義中、各置換基の端部に位置するアリール環、一部水素添加されたアリール基および複素環は、更にフッ素原子、塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子; メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基等の $C_1 \sim C_5$ のアルキル基; トリフルオロメチル基; メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、tert-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基等の $C_1 \sim C_5$ のアルコキシ基; メチレンジオキシ基、エチレンジオキシ基、プロピレンジオキシ基、ブチレンジオキシ基等の $C_1 \sim C_5$ の環状アセタール残基; ヒドロキシル基; アセトキシ基、プロピオニルオキシ基、ブチリルオキシ基、バレリルオキシ基等の $C_2 \sim C_6$ のアシルオキシ基; ホルミル基; カルボキシ基; メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基等の $C_2 \sim C_6$ のアルコキシカルボニル基; オキソ基; アセチル基、プロピオニル基、ブチル基、バレリル基等の $C_2 \sim C_6$ のアシル基; アミノ基; メチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、イソブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基、ペンチルアミノ基、イソペンチルアミノ基等の $C_1 \sim C_5$ のモノアルキルアミノ基; ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルプロピルアミノ基、ジイソプロピルアミノ基等の $C_2 \sim C_{10}$ のジアルキルアミノ基; アセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、イソプロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、イソブチリルアミノ基、バレリルアミノ基等の $C_2 \sim C_6$ のアシルアミノ基; カルバモイル基; メチルカルバモイル基、エチルカルバモイル基、プロピルカルバモイル基、イソプロピルカルバモイル基、ブチルカルバモイル基、tert-ブチルカルバモイル基、ペンチルカルバモイル基等の $C_2 \sim C_6$ のアルキルカルバモイル基; フェニル基、トリル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、アントリル基等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基; および R^{10} で定義した

のと同様な複素環残基から選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。

【0032】

【化11】

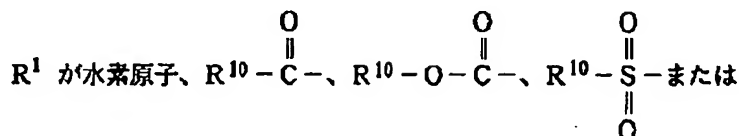


【0033】(R¹¹は置換基を有していてもよいC₁～C₁₅のアルキル基を表す。)を表す化合物が好ましく、特にR⁹が-(CH₂)_m-X(Xはヒドロキシル基、C

₁～C₅のアルキルチオ基、C₂～C₆のアルコキシカルボニルアミノ基、置換基を有していてもよい複素環残基、アミノ基、C₁～C₅のモノアルキルアミノ基、C₂～C₁₀のジアルキルアミノ基、C₂～C₆のアシルアミノ基、ハロゲン原子、C₁～C₅のアルコキシ基、置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基または置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリールオキシ基を表し、mは1～10の整数を表す。)を表す化合物がより好ましい。更に一層好ましい化合物は、

【0034】

【化12】



【0035】(R¹⁰は置換基を有していてもよいC₁～C₁₅のシクロアルキル基、C₃～C₁₅のシクロアルケニル基、置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基、置換基を有していてもよいC₁₀～C₁₄の一部水素添加されたアリール基、置換基を有していてもよい複素環残基、C₃～C₁₅のシクロアルキルオキシ基、置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリールオキシ基、置換基を有していてもよいC₆～C₁₄の一部水素添加されたアリールオキシ基、置換基を有していてもよい複素環オキシ基、置換基を有していてもよいC₇～C₂₀のアラルキルオキシ基および置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリールチオ基から選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁～C₁₅のアルキル基；C₃～C₁₅のシクロアルキル基；置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基；置換基を有していてもよいC₆～C₁₄の一部水素添加されたアリール基；置換基を有していてもよいC₂～C₁₀のアルケニル基または置換基を有していてもよい複素環残基を表す。)を表し、R⁴およびR⁶がそれぞれ独立して水素原子またはC₁～C₅のアルキル基を表し、R⁵が水素原子、置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基、C₁～C₁₀のアルコキシ基または置換基を有していてもよいC₁～C₁₅のアルキル基を表し、R⁷がC₃～C₁₅のシクロアルキル基、ヒドロキシル基、複素環残基で置換されていてもよいC₁～C₅のアルコキシ基、C₆～C₁₄のアリールオキシ基、C₇～C₂₀のアラルキルオキシ基、複素環残基で置換されていてもよいC₁～C₅のアルキルチオ基、C₆～C₁₄のアリールチオ基、C₇～C₂₀のアラルキルチオ基、カルボキシ基、カルバモイル基、C₂～C₆のアルコキシカルボニル基および複素環残基から選ばれる1以上の置換

基を有していてもよいC₁～C₁₅のアルキル基；水素原子；置換基を有していてもよいC₆～C₁₄のアリール基またはC₁～C₁₀のアルコキシ基を表し、R⁸が水素原子を表す化合物である。

【0036】前記一般式(I)で表される本発明のケトン誘導体は、薬学的に許容される塩を形成することができる。かかる塩の具体例としては、酸性基が存在する場合には、リチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、マグネシウム塩、カルシウム塩等の金属塩、またはアンモニウム塩、メチルアンモニウム塩、ジメチルアンモニウム塩、トリメチルアンモニウム塩、ジシクロヘキシルアンモニウム塩等のアンモニウム塩を形成することができ、塩基性基が存在する場合には塩酸塩、臭酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩等の鉱酸塩、あるいはメタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩、酢酸塩、プロピオン酸塩、酒石酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、リンゴ酸塩、シュウ酸塩、コハク酸塩、クエン酸塩、安息香酸塩、マンデル酸塩、ケイ皮酸塩、乳酸塩等の有機酸塩を形成することができる。

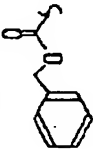
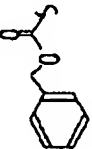

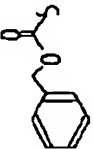

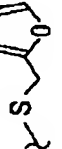
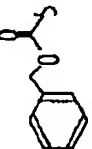
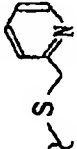
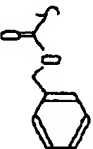
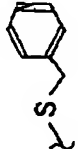
【0037】上記一般式(I)で示されるケトン誘導体の二重結合部位の立体化学については、(E)体、(Z)体、あるいは(EZ)体をとることができる。また、不斉炭素の立体化学については、それぞれ独立して(R)体、(S)体、あるいは(RS)体をとることができる。上記一般式(I)で表されるケトン誘導体の具体的な例としては、n=0の場合は下記表-1に示す化合物が、n=1の場合には下記表-2に示す化合物が挙げられる。

【0038】

【表1】

【0039】

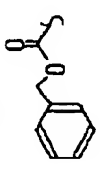
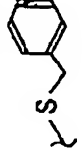
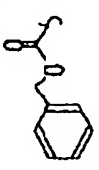
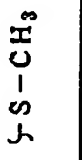
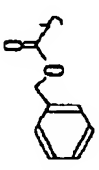
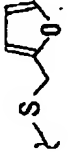
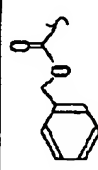


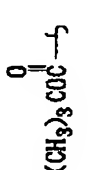


表-1 (n=0の場合)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
1		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	-S-CH ₃
2		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	
3		H		H	H	H	
4		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	
5		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	

【表2】

[0040]





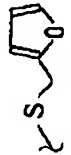
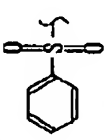

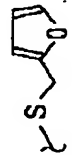
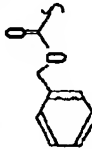
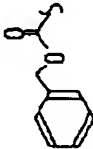
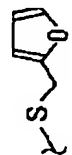
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁸
6		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	
7		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	H	
8		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	H	
9		H	-CH ₂ - 	H	-CH ₃	H	
10		H	-CH ₂ - 	H	-CH ₃	H	

[表3]

【0041】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
1 1	H	H		H	-CH ₃	H	
1 2		H		H	-CH ₃	H	
1 3		H		H	-CH ₃	H	
1 4		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	-CH ₃	-S-CH ₃
1 5		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	-CH ₃	

【表4】

【0042】

表-1 ($n=0$ の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
16		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	-CH ₃	
17		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	-CH ₃	
18		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	-CH ₃	
19		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH(CH ₃) ₂	H	-S-CH ₃
20		H	-CH(CH ₃) ₂	H	-CH(CH ₃) ₂	H	

【表 5】

【0043】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
2 1		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH(CH ₃) ₂	H	
2 2		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH(CH ₃) ₂	H	
2 3	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH(CH ₃) ₂	H	
2 4		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH(CH ₃) ₂	H	
2 5		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH(CH ₃) ₂	H	

【表6】

【0044】

表-1 (n=0の場合) つづき

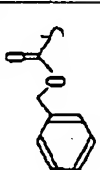
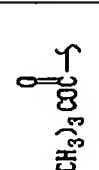
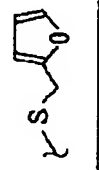
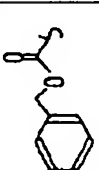

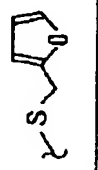
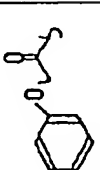



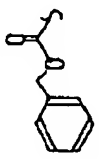
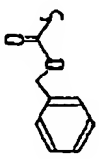

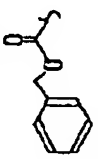

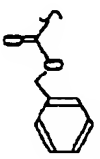
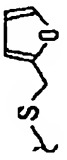
化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
26		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	-S-CH ₃
27		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
28		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
29	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
30		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

表7

【0045】

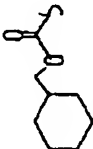


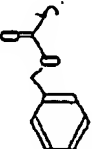
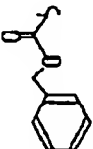

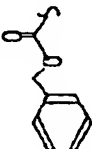
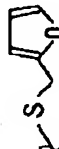
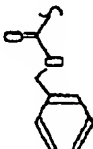

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
3 1		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
3 2		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-S-CH ₃
3 3		H	-CH ₂ - 	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-S-CH ₃
3 4		H	-CH ₃	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	
3 5		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	

【表8】

【0046】

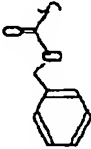

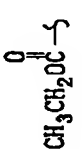

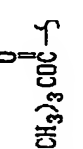
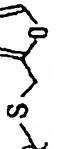




表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
36		H		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	
37		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	-S-CH ₃
38		H	H	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
39		H	-CH ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
40		H	-CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表9】

【0047】

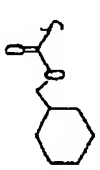



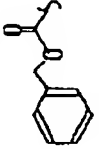

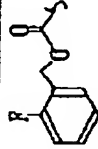

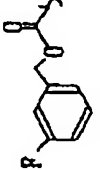

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
4 1		H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
4 2		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
4 3		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
4 4		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
4 5		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表10】

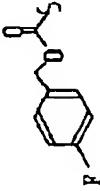

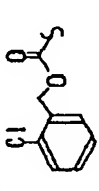

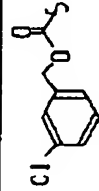
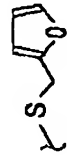
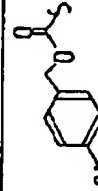

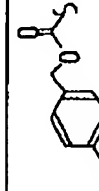

[0048]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
46		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
47		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
48		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
49		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
50		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

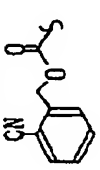
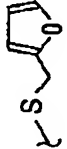

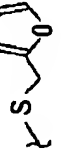
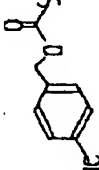



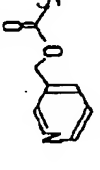
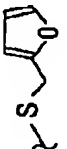
[0049]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
5 1		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
5 2		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
5 3		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
5 4		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
5 5		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[0050]

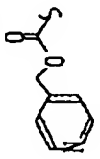




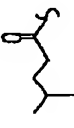

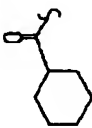

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
56		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
57		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
58		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
59		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
60		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[表1B]

[0051]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
6 1		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
6 2	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
6 3		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
6 4		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
6 5		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【0052】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
66		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
67		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
68		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
69		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
70		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【0053】

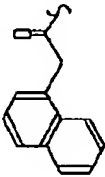

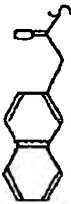


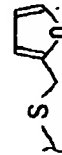




表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
7 1		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
7 2		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
7 3		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
7 4		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
7 5		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表1.6】

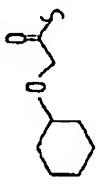

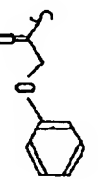

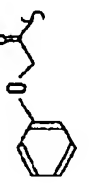



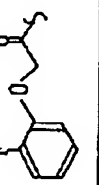
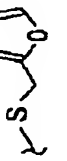
【0054】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
76		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
77		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
78		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
79		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
80		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[0055]

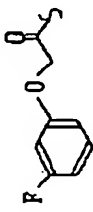

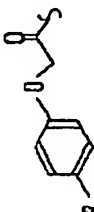

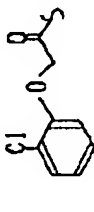



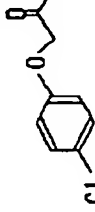
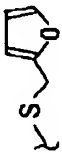
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
81		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
82		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
83		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
84		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
85		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[表18]

【0056】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
86		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
87		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
88		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
89		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
90		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【0057】



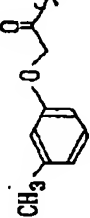

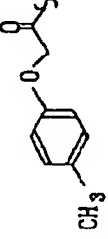
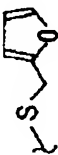
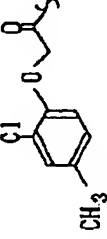

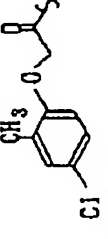
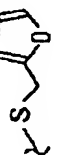
【0057】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
9 1		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
9 2		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
9 3		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
9 4		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
9 5		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[0058]

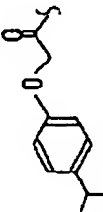

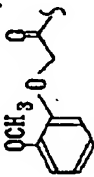

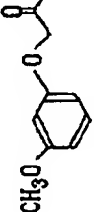

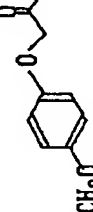

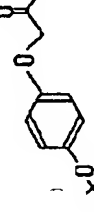
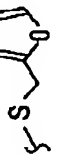
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
96		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
97		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
98		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
99		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
100		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[表21]

[0059]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
101		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
102		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
103		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
104		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
105		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[表 2]

[0060]

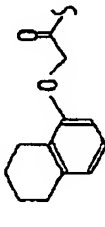
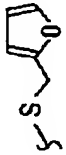
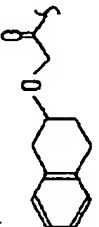

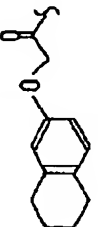

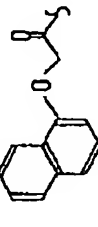
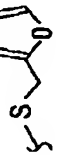
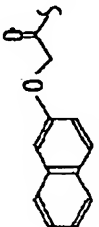

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
106		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
107		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
108		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
109		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
110		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[表2.3]

【0061】

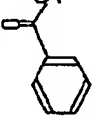

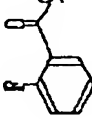
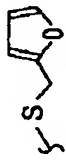
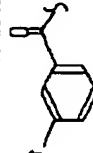
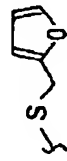
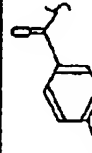
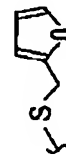
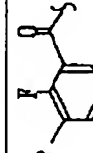
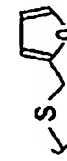
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
111		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
112		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
113		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
114		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
115		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表24】

[0062]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
116		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
117		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
118		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
119		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
120		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[表25]

[0063]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R1	R4	R5	R6	R7	R8	-A-R9
121		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
122		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
123		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
124		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
125		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[表26]

【0064】

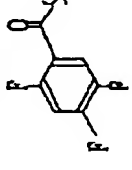

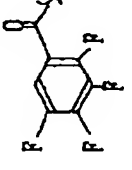

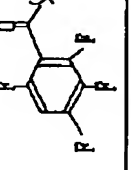
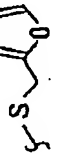
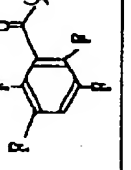
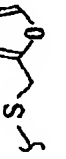
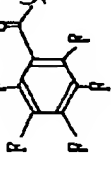
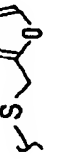
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
126		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
127		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
128		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
129		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
130		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表27】

【0065】

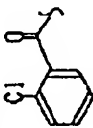

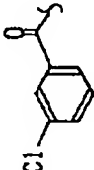

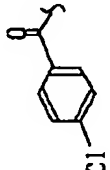

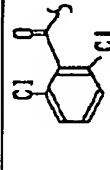

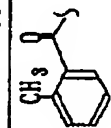

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
131		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
132		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
133		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
134		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
135		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表28】

[0066]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
136		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
137		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
138		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
139		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
140		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【0067】

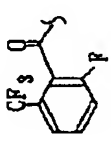

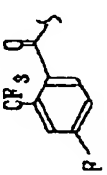

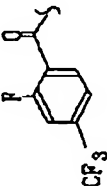

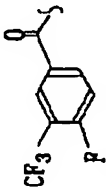

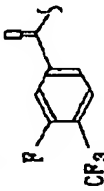
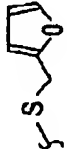
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
141		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
142		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
143		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
144		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
145		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【0068】

[0068]

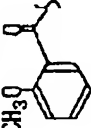
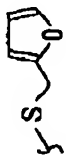
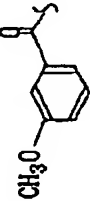
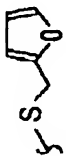
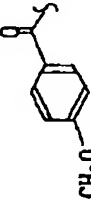

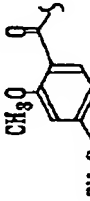

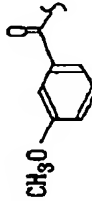
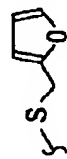
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
146		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
147		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
148		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
149		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
150		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[表3.1]

【0069】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
151		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
152		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
153		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
154		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
155		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表32】

[0070]

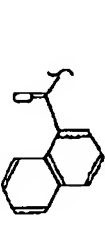

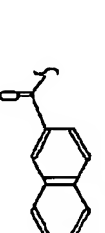



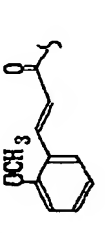
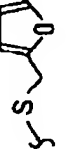
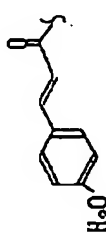

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
156		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
157		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
158		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
159		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
160		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[表3-8]

【0071】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
161		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
162		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
163		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
164		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
165		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表34】

【0072】

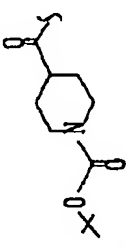

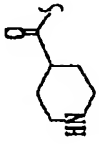
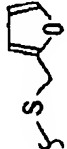
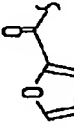

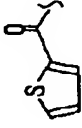

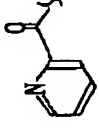

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
166		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
167		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
168		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
169		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
170		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表35】

【0073】

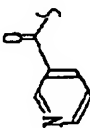

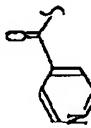

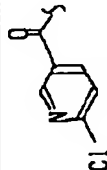

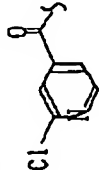

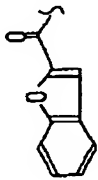

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
171		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
172		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
173		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
174		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
175		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表3.6】

【0074】

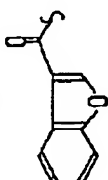

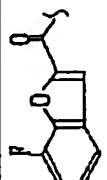



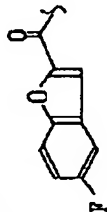

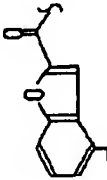
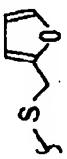
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
176		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
177		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
178		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
179		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
180		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表3.7】

【0075】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁸
181		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
182		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
183		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
184		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
185		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表3B】

【0076】

表-1 (n=0の場合) つづき




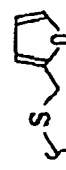
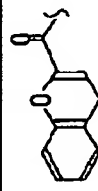

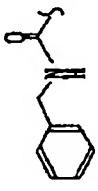
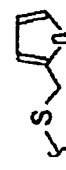
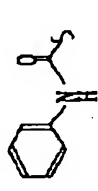

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
186		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
187		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
188		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
189		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
190		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

表39

【 0 0 7 7 】

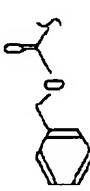


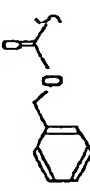
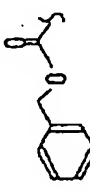
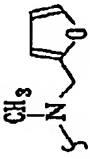


表-1 ($n=0$ の場合) つづき

化合物	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
191		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
192		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
193		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
194		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
195		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	5-O-CH ₃

【表40】

【0078】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
196		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
197		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	5-N(CH ₃) ₂
198		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	5-N(CH ₂ CH ₃) ₂
199		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
200		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表4-1】

【0079】

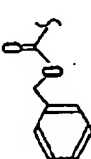

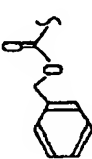



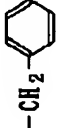
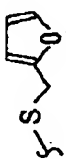
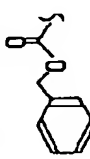

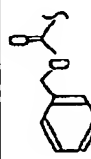

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁸
201		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
202		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
203		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
204		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
205		H		H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表42】

[0080]



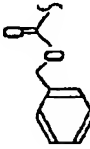

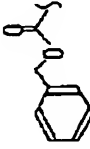

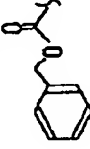

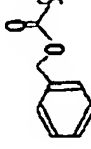

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
206		H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
207		H		H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
208		H		H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
209		H	-CH ₂ OCH ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
210		H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表4B】

[0081]

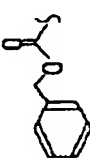
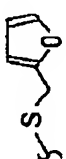
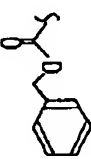
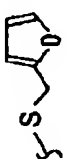



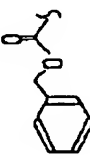
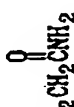

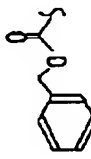
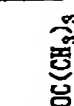
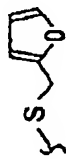
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
211		H	-CH ₂ OH	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
212		H	-CH ₂ COOCH ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
213		H	-CH ₂ COOC(CH ₃) ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
214		H	-CH ₂ COOH	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
215		H	-CH ₂ CH ₂ COOCH ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[表44]

【0082】

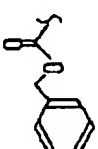

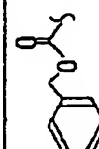
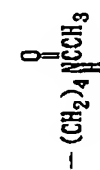
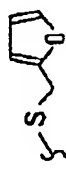
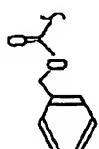
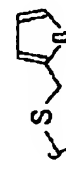
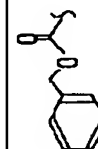
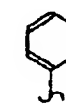

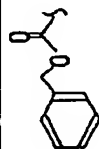

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
216		H	-CH ₂ CH ₂ COOC(CH ₃) ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
217		H	-CH ₂ CH ₂ COOH	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
218		H		H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
219		H		H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
220		H		H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表45】

【0083】

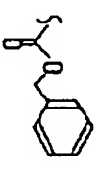
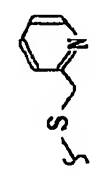
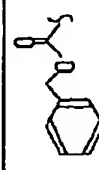
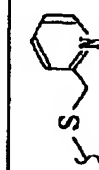
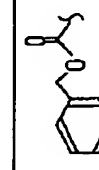
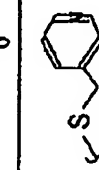
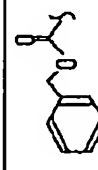
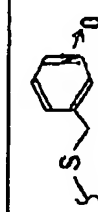

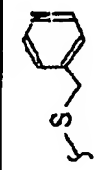
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
2 2 1		H	-(CH ₂) ₄ NH ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
2 2 2		H		H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
2 2 3		H	-CH ₂ CH ₂ SCCH ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
2 2 4		H		H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
2 2 5		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表46】

[0084]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
226		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
227		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
228		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
229		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
230		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[表 4.7]

【0085】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
231		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
232		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
233		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
234		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
235		H	-CH(CH ₃) ₂	H		H	

【表4.8】

[0086]

表-1 (n=0の場合) つづき

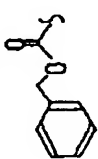
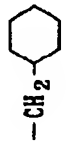
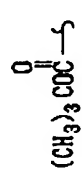


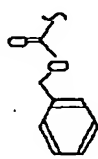




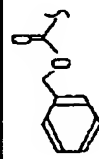
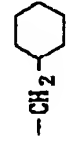

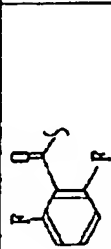


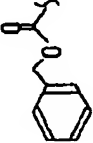

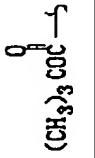

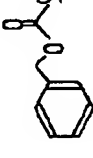

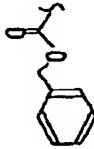

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
236		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
237		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
238		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
239	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
240		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

表49

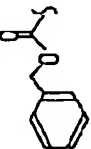

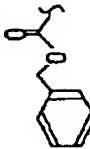



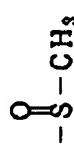
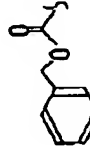

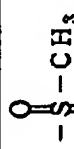

【0087】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
241		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
242		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-H
243		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
244		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
245		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃

[0088]

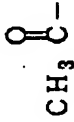

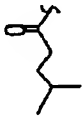

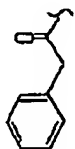

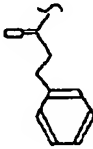

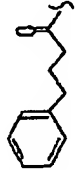

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
246		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
247		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
248		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
249		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
250	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃

[表51]

【0089】

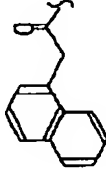

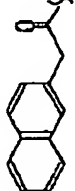



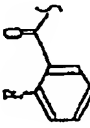

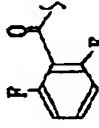

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
251		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
252		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
253		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
254		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
255		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃

【表52】

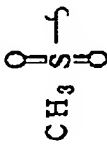

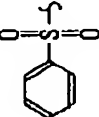

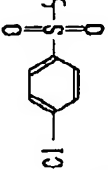

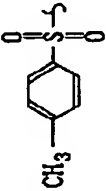

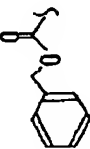

[0090]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁸
256		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
257		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
258		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
259		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
260		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃

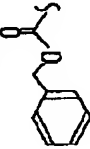

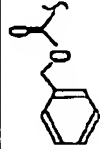

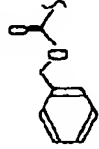

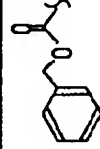

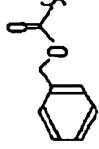

[0091]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
261		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
262		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
263		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
264		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
265		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₂ CH ₃

[0092]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
266		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-(CH ₂) ₃ CH ₃
267		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-(CH ₂) ₅ CH ₃
268		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-(CH ₂) ₇ CH ₃
269		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-(CH ₂) ₁₁ CH ₃
270		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-(CH ₂) ₁₉ CH ₃

[表55]

[0093]

表-1 (n=0の場合) つづき

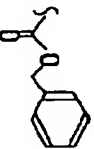

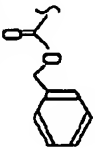



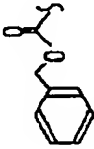

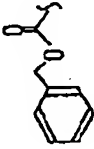

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
271		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₂ CH ₂ Cl
272		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
273		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₂ CH ₂ OH
274		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₂ CH ₂ SCH ₃
275		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂

表5.6

[0094]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
276		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-S-CH ₂ CH ₂ -C(=O)CH ₃
277		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-S-CH ₂ -
278		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-S-CH ₂ -CH ₂ -
279		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-S-
280		H	H	H	-CH ₂ -	H	

[0095]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
281		H	-CH ₃	H		H	
282		H	-CH(CH ₃) ₂	H		H	
283		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
284		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
285		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	

[表58]

[0096]

表-1 (n=0の場合) つづき


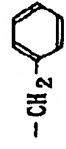


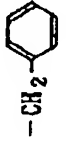

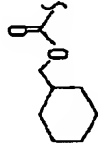
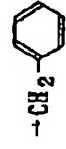


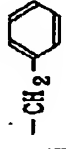




化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
286		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
287		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
288		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
289		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
290		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

表5.9

[0097]

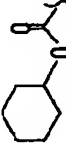

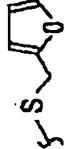


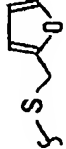





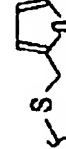



表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
291		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
292		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
293		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
294		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
295		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

[296]

【0098】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁸
296		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
297		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
298		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	-CH ₂ - 	H	
299		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
300		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	-CH ₂ - 	H	

【表61】

[0099]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
301		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
302		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
303		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
304		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
305		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

[表62]

[0100]

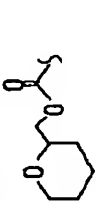




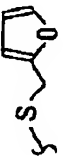
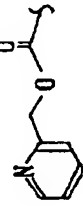

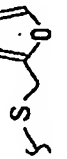






表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
306		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
307		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
308		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
309		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
310		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

[表63]


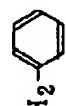

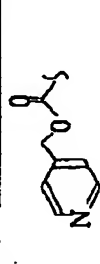
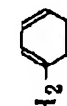
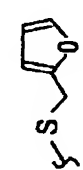
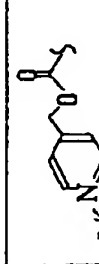
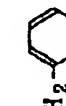
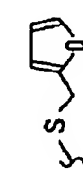
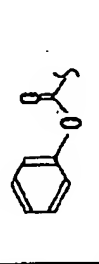
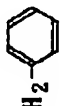

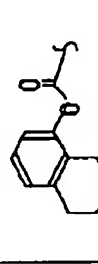
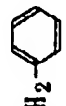
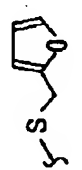
[0101]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
311		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
312		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
313		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
314		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
315		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

[0102]

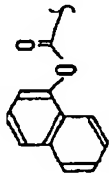


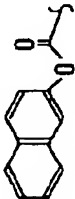



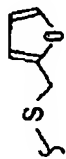
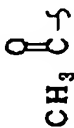





表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
316		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
317		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
318		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
319		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
320		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

[薬65]

[0103]

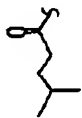



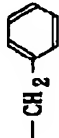

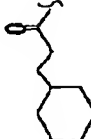



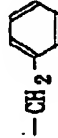

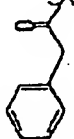


表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
3 2 1		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
3 2 2		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
3 2 3	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
3 2 4		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
3 2 5		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

[表 6-6]

[0104]

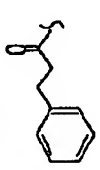





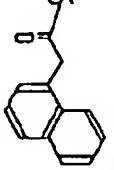


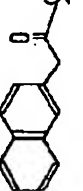


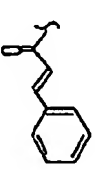


表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
326		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
327		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
328		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
329		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
330		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	

[328-330]

[0105]

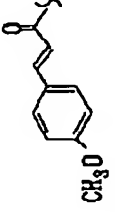


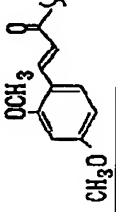








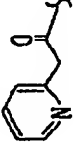


表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁸
331		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
332		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
333		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
334		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
335		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

[表68]







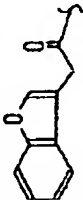


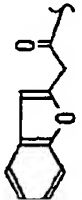





[0106]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁸
336		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
337		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
338		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
339		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
340		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

【0107】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
341		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
342		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
343		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
344		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
345		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

【0108】

[0108]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
346		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
347		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
348		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
349		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
350		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	

表7

【0109】

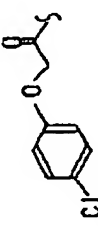

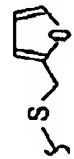
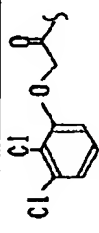


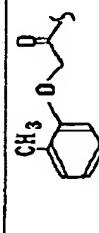

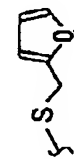


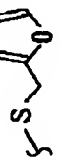
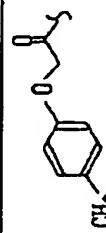


表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
351		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
352		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
353		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
354		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
355		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

【表72】

[0110]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
356		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
357		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
358		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
359		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
360		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

[表7.8]






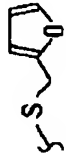
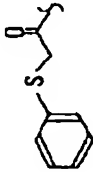

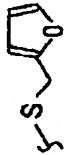
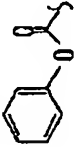


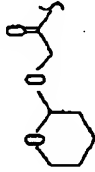


[0111]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
361		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
362		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
363		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
364		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
365		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

【0112】

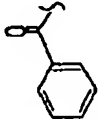


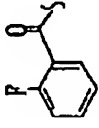


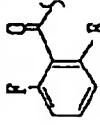


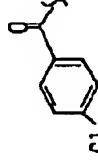


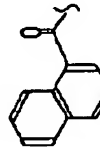


表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
366		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
367		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
368		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
369		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
370		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

【表-15】

【0113】

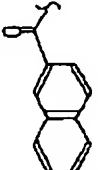

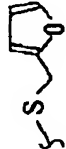
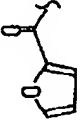
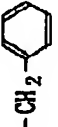


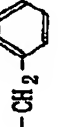
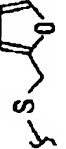
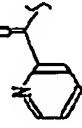
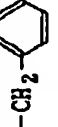

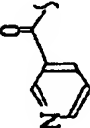


表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
371		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
372		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
373		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
374		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
375		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

【表7.6】

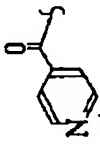

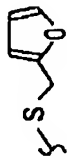






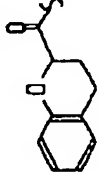


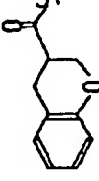


[0114]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
376		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
377		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
378		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
379		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
380		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	

[0115]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
381		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
382		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
383		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
384		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
385		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

[表7B]

[0116]

表-1 (n=0の場合) つづき

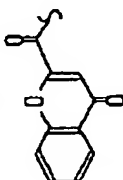


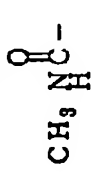


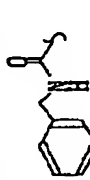


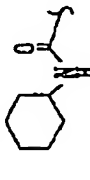


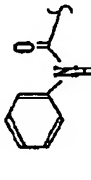


化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
386		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
387		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
388		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
389		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
390		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

表79

【0117】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
391		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
392		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
393		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
394		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
395		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	

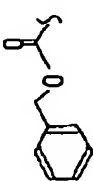




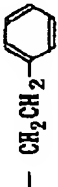


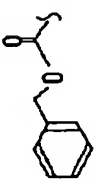


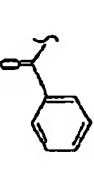


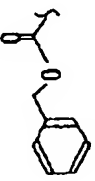
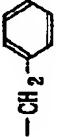

[0118]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
396		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2-C6H5	H	
397		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2-C6H5	H	
398		H	-CH(CH3)CH2CH3	H	-CH2-C6H5	H	
399		H	-CH2CH2CH2CH3	H	-CH2-C6H5	H	
400		H	-CH2-C6H11	H	-CH2-C6H5	H	

【0119】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
401		H		H		H	
402		H		H		H	
403		H	-OCH ₃	H		H	
404		H	-OCH ₃	H		H	
405		H	-OCH(CH ₃) ₂	H		H	

【表83】

【0120】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
406		H	-OCH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
407		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
408		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
409		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
410		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

【表83】

[0121]




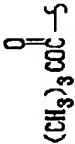
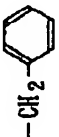

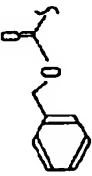




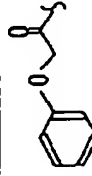
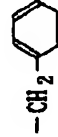

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
411		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
412		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
413		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
414		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
415		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

[表84]

[0122]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
416		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
417		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
418		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
419	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
420		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	

[表85]

【0123】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
4 2 1		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
4 2 2		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
4 2 3		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
4 2 4		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
4 2 5		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

— 86 —

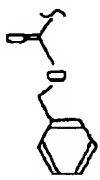

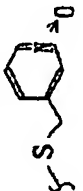


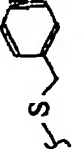


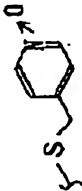
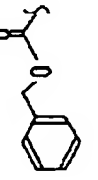




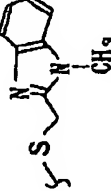
[0124]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
426		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
427		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
428		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
429		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
430		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

【0125】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
431		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
432		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
433		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
434		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
435		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

【表88】

【0126】

表-1 (n=0の場合) つづき

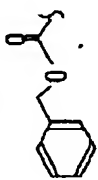

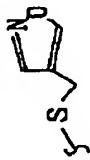


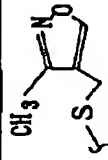



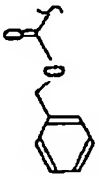

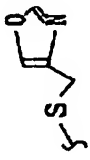






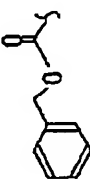

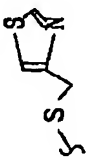

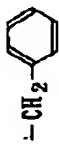


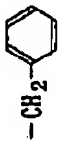

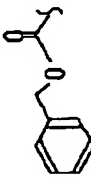
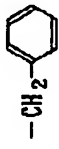

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
436		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
437		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
438		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
439		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
440		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

表89

【0127】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
441		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
442		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
443		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
444		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
445		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	

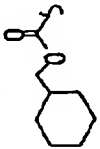

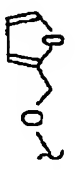
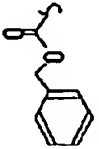

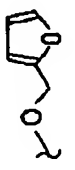
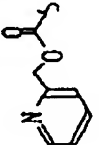

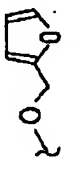


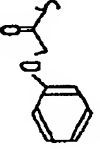


[0128]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁸
446		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
447		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-O-CH ₃
448		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-O-CH ₂ CH ₃
449		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-O-CH ₂ CH ₂ CH ₃
450		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

【0129】

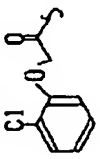


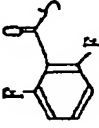


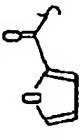


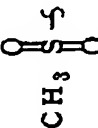


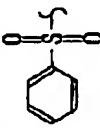


表-1 (n=0の場合)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
451		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
452		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
453		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
454	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
455		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

【表92】

[0130]

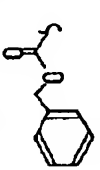

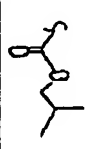



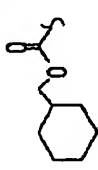

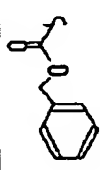

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
456		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
457		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
458		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
459		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
460		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

[表93]

【0131】

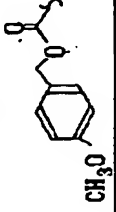




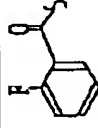

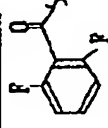

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
461		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-NH(CH ₃) ₂
462		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-N(CH ₃) ₂
463		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-N(CH ₃) ₂
464		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-N(CH ₃) ₂
465		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-N(CH ₃) ₂

【表94】

【0132】

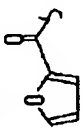

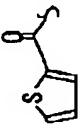

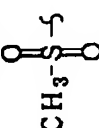

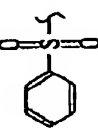

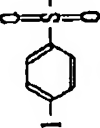

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
466		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-N(CH ₃) ₂
467	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-N(CH ₃) ₂
468		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-N(CH ₃) ₂
469		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-N(CH ₃) ₂
470		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-N(CH ₃) ₂

【表95】

【0133】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁸
471		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-N(CH ₃) ₂
472		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-N(CH ₃) ₂
473		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-N(CH ₃) ₂
474		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-N(CH ₃) ₂
475		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-N(CH ₃) ₂

【表96】

【0134】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
476		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2-C6H5	H	
477		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2-C6H5	H	
478		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2-C6H5	H	
479		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2-C6H5	H	
480	H	H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2-C6H5	H	

【表97】

【0135】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
481		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
482		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
483		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
484		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
485		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

【表98】

【0136】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
486		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
487		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
488		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
489		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
490		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

【表99】

[0137]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
491		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
492		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
493		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
494		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
495		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	

【表100】

【0138】

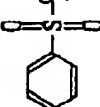


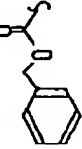
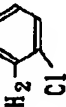

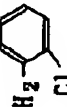


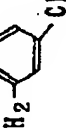
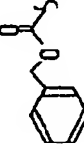
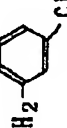

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
496		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
497	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
498		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
499		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
500		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	

【表101】

[0139]

表-1 (n=0の場合)

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
501		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
502		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
503		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
504		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
505		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

[表102]

【0140】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
506		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
507		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
508		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
509		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
510	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	

【表103】

【0141】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
511		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
512		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
513		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
514		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
515		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

【表104】

[0142]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
516		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-S-CH ₃
517		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
518		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-S-CH ₃
519		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
520		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-S-CH ₃

[表105]

【0143】

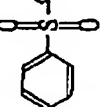


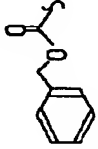




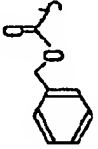


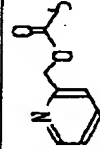


表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
521		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
522		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
523		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
524	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
525		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	

【表106】

【0144】

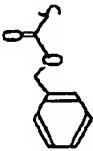
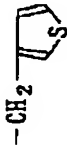
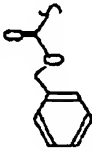


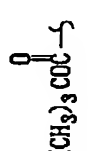

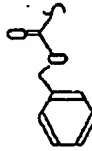


表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
526		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
527		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
528		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
529		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
530		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

【表107】

【0145】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
531		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
532		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
533		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
534		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
535	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃

【表108】

【0146】

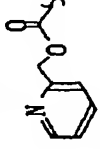

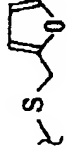


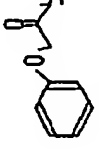


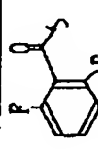


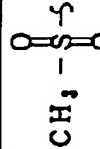

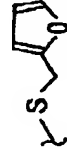
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
536		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ -	H	-S-CH ₃
537		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ -	H	-S-CH ₃
538		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ -	H	
539		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ -	H	
540		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ -	H	

【表109】

【0147】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
541		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ - 	H	
542	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ - 	H	
543		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ - 	H	
544		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ - 	H	
545		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ - 	H	

【表110】

【0148】

表-1 (n=0の場合) つづき

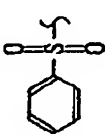


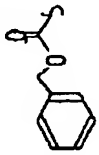
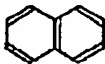
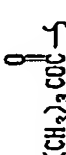
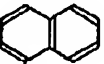


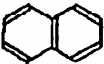

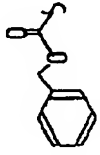
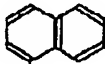

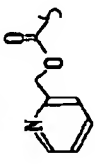







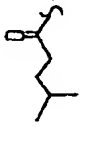



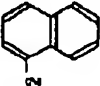

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
546		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ - 	H	
547		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
548		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
549		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
550		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

表-1-1-1

【0149】

表-1 (n=0の場合)

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
551		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
552		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
553	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
554		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
555		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

【表112】

[0150]


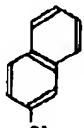
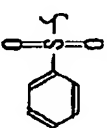
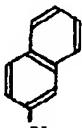
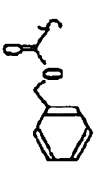
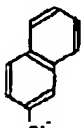

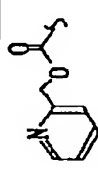
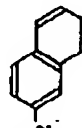

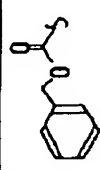

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
556		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
557		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
558		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
559		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
560	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃

[表113]

【0151】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
561		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
562		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
563		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
564		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
565		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃

【表114】

【0152】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ³
566		H	-CH2CH(CH3)2	H		H	
567		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2OCH3	H	-S-CH3
568		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2OCH3	H	
569		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2OCH2CH3	H	-S-CH3
570		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2OCH2CH3	H	

【表115】

[0153]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
571		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ OCH ₂ -	H	-S-CH ₃
572		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ OCH ₂ -	H	
573		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ OCH ₂ -	H	-S-CH ₃
574		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ OCH ₂ -	H	-S-CH ₃
575	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ OCH ₂ -	H	-S-CH ₃

【0154】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
576		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ -	H	-S-CH ₃
577		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ -	H	
578		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ SCH ₃	H	-S-CH ₃
579		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ SCH ₃	H	
580		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ SCH ₂ CH ₃	H	-S-CH ₃

【表117】

【0155】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
581		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
582		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
583		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	
584		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	-S-CH ₃
585		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	

【表118】

【0156】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
586		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
587		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
588		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
589	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃
590		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	-S-CH ₃

[0157]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
591		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ S-CH ₂ -	H	-S-CH ₃
592		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ S-CH ₂ -	H	
593		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ COOCH ₃	H	-S-CH ₃
594		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ COOCH ₃	H	
595		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ COOH	H	-S-CH ₃

[薬130]

[0158]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
596		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ COOH	H	
597		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ COOCH ₃	H	-S-CH ₃
598		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ COOCH ₃	H	
599		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ COOH	H	-S-CH ₃
600		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ COOH	H	

[表121]

化合物	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
601		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	H	-S-CH ₃
602		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
603		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
604		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
605	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表 122】

【0160】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
606		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
607		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-OCH ₂ -		
608		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-OCH ₂ -		
609		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H			
610		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H			

【表123】

【0161】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
611		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H			
612		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H			
613		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H			
614		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H			
615	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H			

【表124】

【0162】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
616		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H			
617		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H			
618		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H			
619		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H			
620		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ -		-S-CH ₃

【表125】

【0163】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁸
621		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ -		
622		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		-S-CH ₃
623		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		
624		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		-S-CH ₃
625		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		

【表126】

[0164]


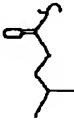
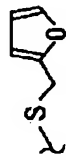
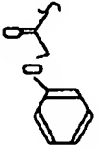

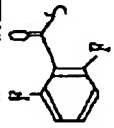

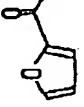

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
626		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		
627		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		
628		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		
629		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		
630		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		

【表127】

[0165]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
631	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		
632		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		
633		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		
634		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		
635		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		

[表128]

—

三

表 1 2.9

【0167】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
641		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2CH2CH2CH2CH2-		-O-CH3
642		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2CH2CH2CH2CH2-		
643		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2CH2CH2CH2CH2-		
644		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2CH2CH2CH2CH3	H	-S-CH3
645		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2CH2CH2CH2CH3	H	

[0168]

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
646		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-S-CH ₃
647		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
648		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	-S-CH ₃
649		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
650		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-S-CH ₃

表-181

[0169]



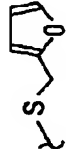







表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
651		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
652		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	-S-CH ₃
653		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
654		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-S-CH ₃
655		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

表-1 82

【0170】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
656		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	-S-CH ₃
657		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
658		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	-S-CH ₃
659		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
660		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【0170】

【0171】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
661		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2CH2CH2CH3	H	
662		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2CH2CH2CH3	H	
663		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2CH2CH2CH3	H	
664		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2CH2CH2CH3	H	
665		-CH2CH2CH2-		H	-CH3	H	-S-CH3

【0172】

表-1 (n=0の場合) つづき

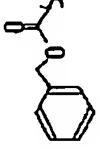
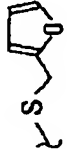
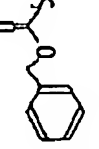
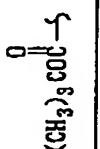
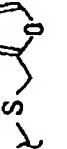
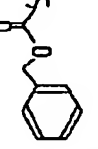
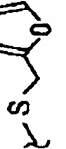

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
666		-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	-	H	-CH ₃	H	
667		-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	-	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	-S-CH ₃
668		-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	-	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
669		-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	-	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
670	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	-	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

表1B.5]

【0173】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁶	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁸
671		-CH2CH2CH2-	-	H	-CH2CH2CH2CH3	H	
672		-CH2CH2CH2-	-	H	-CH2CH2CH2CH3	H	
673		-CH2CH2CH2-	-	H	-CH2-	H	-S-CH3
674		-CH2CH2CH2-	-	H	-CH2-	H	
675			-	H	-CH2-	H	-S-CH3

【表136】

【0174】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
676			OH $\text{CH}_2\text{CHCH}_2\text{—}$	H	$\text{—CH}_2\text{—}$ 	H	
677			O $\text{CH}_2\text{CCH}_2\text{—}$	H	$\text{—CH}_2\text{—}$ 	H	—S—CH_3
678			O $\text{CH}_2\text{CCH}_2\text{—}$	H	$\text{—CH}_2\text{—}$ 	H	
679			$\text{—CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{—}$	H	$\text{—CH}_2\text{—}$ 	H	—S—CH_3
680			$\text{—CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{—}$	H	$\text{—CH}_2\text{—}$ 	H	

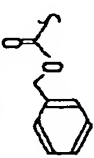
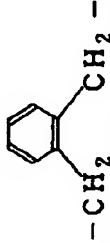

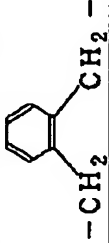

表187]

【0175】
【表138】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
681				H		H	
682				H		H	
683				H		H	
684	H			H		H	
685				H		H	

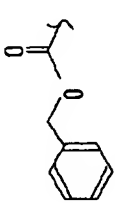
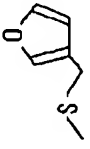
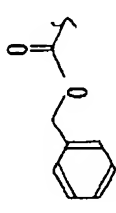

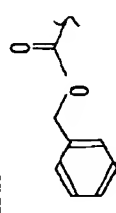
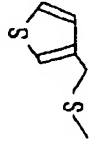
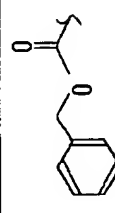
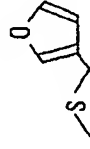
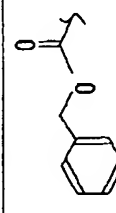
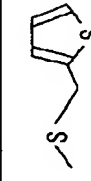
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
686				H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	-S-CH ₃
687				H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【0176】
【表139】

【0177】

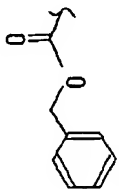
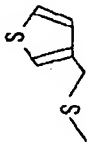
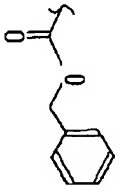
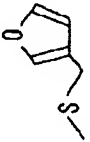
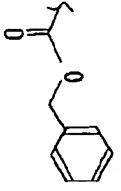

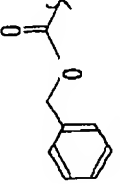
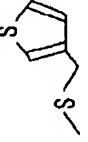
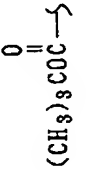

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
688		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	
689		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	
690		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	
691		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	H	
692		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	H	

【表140】

【0178】

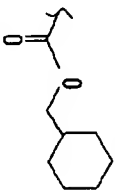
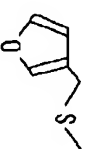
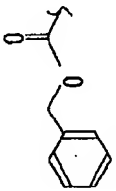
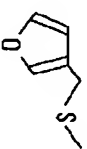

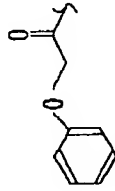
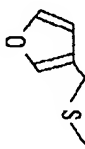
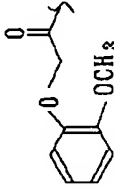
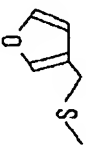
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
693		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	H	
694		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH(CH ₃) ₂	H	
695		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH(CH ₃) ₂	H	
696		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH(CH ₃) ₂	H	
697		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	

【表141】

【0179】

表-1 (n = 0 の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
698		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	
699		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	
700	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	
701		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	
702		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	

【0142】

【0180】

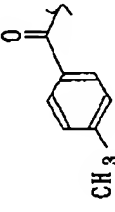
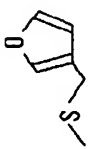
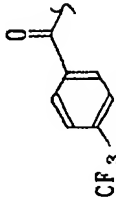
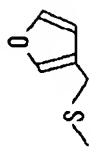
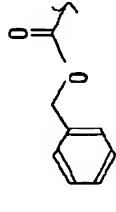
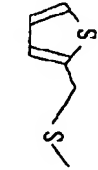
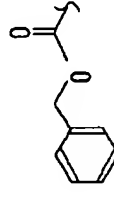
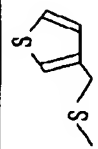
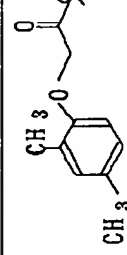
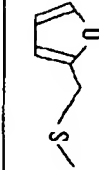
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
703		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	
704		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	
705		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	
706		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	
707		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	

【表143】

【0181】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
708		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	
709		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	
710		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	
711		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	
712		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【0184】

【0182】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
713		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
714		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
715		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
716		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
717		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表145】

【0183】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
718		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
719		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
720		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
721		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
722		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表146】

【0184】

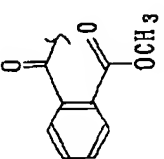

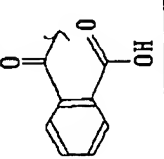

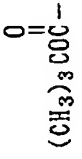
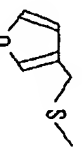
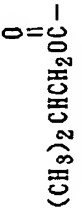
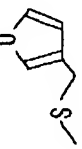
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
7 2 3		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
7 2 4		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
7 2 5		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
7 2 6		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表147】

【0185】

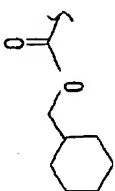
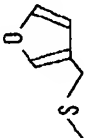
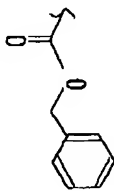
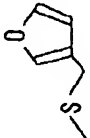
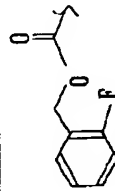
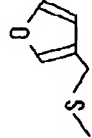
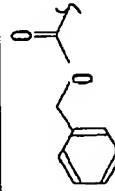
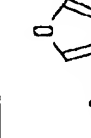
表-1 (n = 0 の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
7 2 7		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
7 2 8		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
7 2 9		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
7 3 0		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表148】

【0186】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
731		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
732		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
733		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
734		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表149】

【0187】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
735		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
736		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
737		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
738		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表150】

【0188】

表-1 (n = 0 の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
7 3 9		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
7 4 0		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
7 4 1		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
7 4 2		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
7 4 3		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【0189】

表-1 (n = 0 の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
744		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
745		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
746		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
747		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
748		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【0189】

【0190】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
749		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
750		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
751		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
752		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
753		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【0191】

【0191】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
754		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
755		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
756		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
757		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
758		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表154】

【0192】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
759		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
760		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
761		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
762		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
763		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表155】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
764		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
765		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
766		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
767		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表156】

【0194】

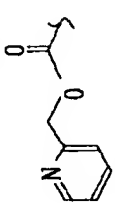
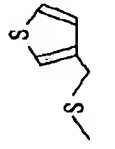

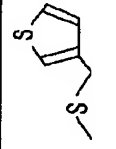
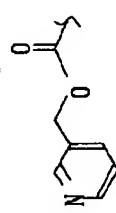
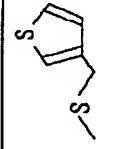
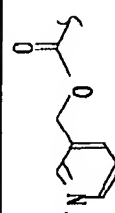
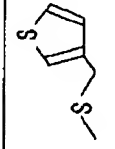
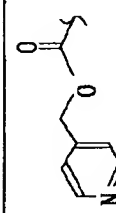
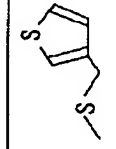
表-1 (n = 0 の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
768		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
769		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
770		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
771		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表-157】

【0195】

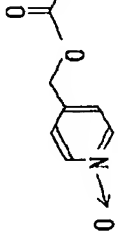
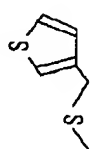
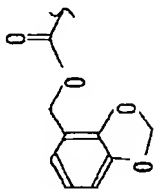
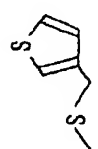
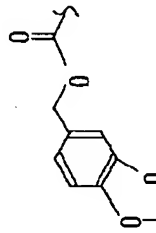
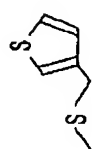
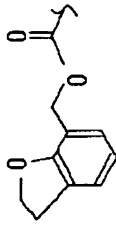
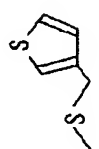
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
772		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
773		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
774		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
775		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
776		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【158】

【0196】

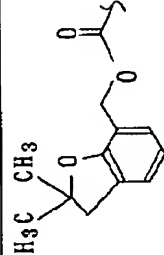
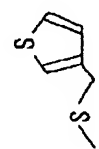
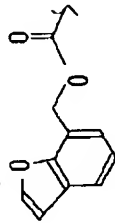
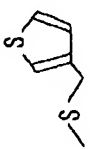
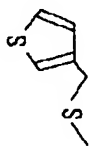
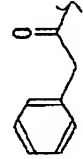
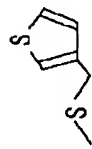
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
777		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
778		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
779		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
780		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表159】

【0197】

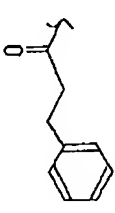
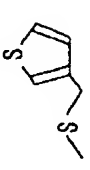
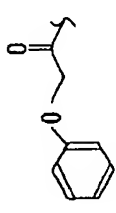
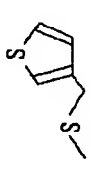
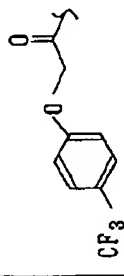
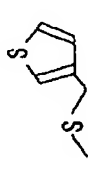
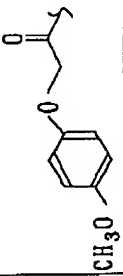

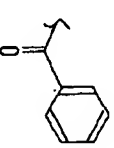
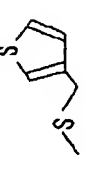
表-1 (n = 0 の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
781		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
782		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
783	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
784		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表160】

【0198】

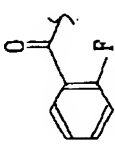
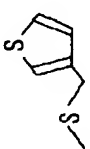
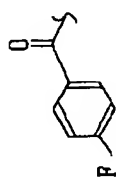
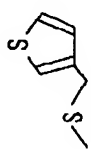
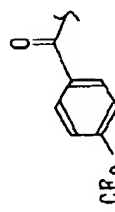
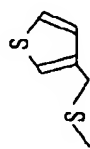
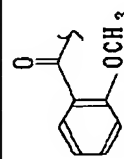
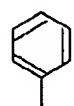

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁸
785		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
786		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
787		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
788		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
789		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表-161】

【0199】

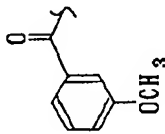


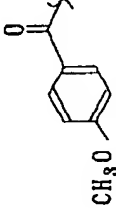


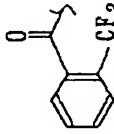


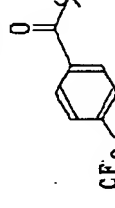


表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
790		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
791		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
792		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
793		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H		H	

【0199】

【0200】


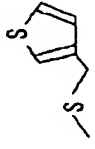

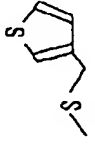
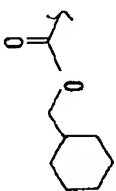


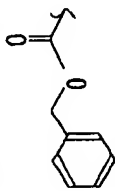

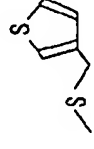
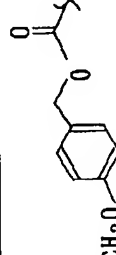


表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
794		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
795		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
796		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
797		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

【表163】

【0201】


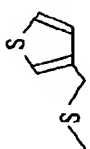
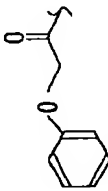

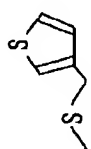
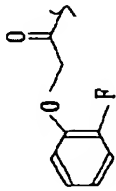

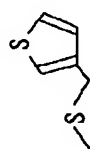
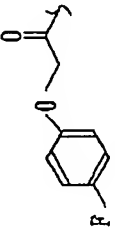

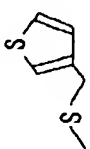
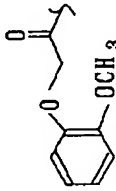

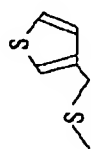
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
798	$(\text{CH}_3)_3\text{COC}-\overset{\text{O}}{\parallel}$	H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	$-\text{CH}_2-$ 	H	
799	$(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}_2\text{OC}-\overset{\text{O}}{\parallel}$	H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	$-\text{CH}_2-$ 	H	
800		H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	$-\text{CH}_2-$ 	H	
801		H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	$-\text{CH}_2-$ 	H	
802		H	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	$-\text{CH}_2-$ 	H	

【表164】

【0202】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
803	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
804		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
805		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
806		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	
807		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ - 	H	

【0203】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
808		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
809		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
810		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
811		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
812		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	

【表166】

【0204】

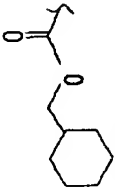
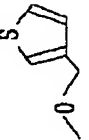
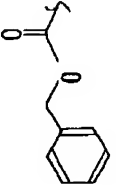
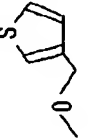
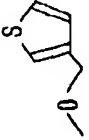
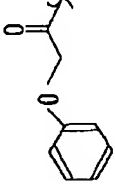
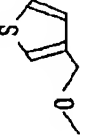
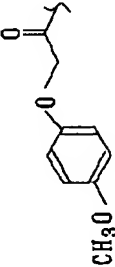
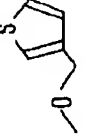
表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
813		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
814		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
815		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
816		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
817		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表1-67】

【0205】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
818		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
819		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
820	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
821		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
822		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【0168】

【0206】

表-1 (n = 0 の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
8 2 3		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
8 2 4		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
8 2 5		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
8 2 6		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
8 2 7		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【表169】

【0207】

表-1 (n=0の場合) つづき

化合物 番号	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
828		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
829		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
830		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

【829】

[0208]

表-2 (n=1の場合)

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
831		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	H	-S-CH ₃
832		H	-CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	H	
833		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-CH ₃	H	
834		H	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -	H	-CH ₃	H	
835		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[表171]

【0209】

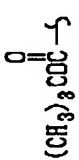

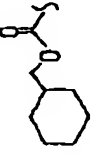


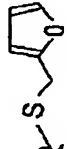
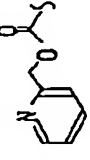



表-2 (n=1の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
836		H	-CH(CH ₃) ₂	H	-CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
837		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
838		H	-CH ₃	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
839		H	-CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
840		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	-S-CH ₃

【表172】

[0210]

表-2 (n=1の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
841		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
842		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
843		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
844		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
845		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[表173]

【表 174】

化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
846	H	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
847		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
848		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
849		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
850		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[0212]

表-2 (n=1の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
851		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
852		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
853		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
854		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
855		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	

[175]

【0213】

表-2 (n=1の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
856		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
857		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	
858		H	-CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
859		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
860		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-S-CH ₃

【表176】

[0214]

表-2 (n=1の場合) つづき

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁸
861		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2-	H	-CH2-	H	-S-CH3
862		H	-CH(CH3)2	H	-CH(CH3)2	H	-CH2-	H	
863		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH(CH3)2	H	-CH2-	H	
864		H	-CH(CH3)2	H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2-	H	
865		H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2CH(CH3)2	H	-CH2-	H	

[表177]

【0215】

表-2 (n=1の場合) つづき

化合物 番	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
866		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	-CH ₂ -	H	
867		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
868		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	
869		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -	H	
870		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH ₂ -	H	

【表178】

表-2 (n=1の場合) つづき

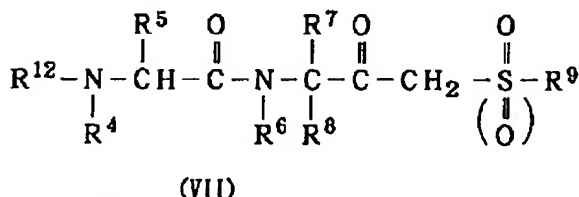
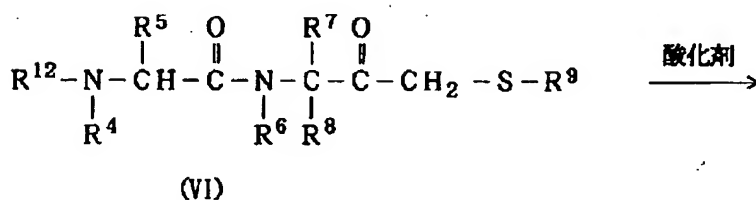
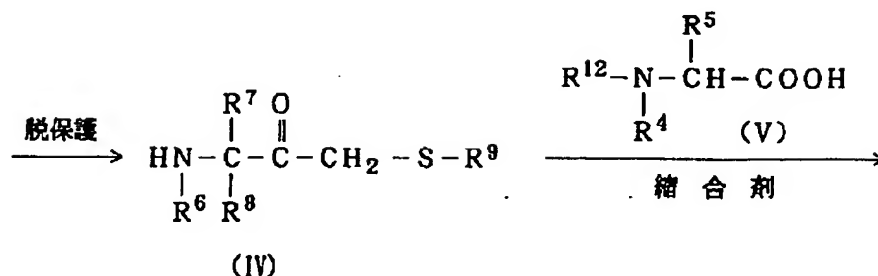
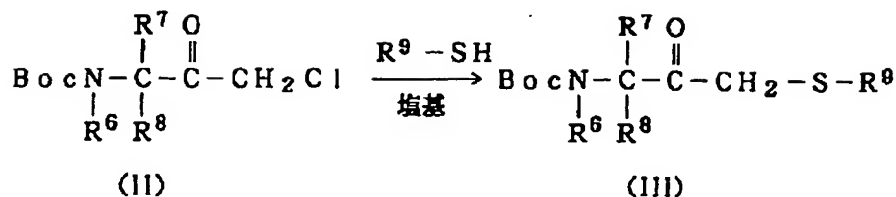
化合物番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	-A-R ⁹
871		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ -	H	-CH ₃	-CH ₃	-S-CH ₃
872		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	-CH ₃	
873		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	-CH ₃	
874		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	-CH ₃	
875		H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	-CH ₃	-CH ₃	

【0216】次に、本発明の化合物の製造法について説明する。本発明のケトン誘導体は、例えば次の様な方法で製造することができる。

【製造法1】

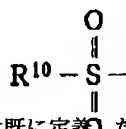
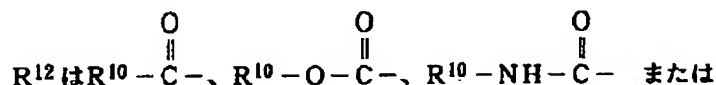
【0217】

【化13】



【0218】（上記一般式において、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^9 は既に定義したとおりであり、

【0219】
【化14】



【0220】（ R^{10} は既に定義したとおり。）を表し、またBocはtert-ブトキシカルボニル基を表す。）

【0221】文献既知の方法（Chemical and Pharmaceutical Bulletin, 37巻, 3108ページ, 1989年）を利用して容易に合成できる上記一般式（II）で表されるクロメチルケトン誘導体を、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、酢酸エチル、塩化メチレン、クロロホルム等に溶解し、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、

水素化ナトリウム、トリエチルアミン、ピリジン等の塩基の存在下、 R^9-SH で表されるメルカプタンを反応させると、上記一般式（III）で表されるチオメチルケトン誘導体得られる。次に化合物（III）のBoc基を、通常用いられる様な反応条件、例えば塩酸水、塩酸-エタノール、塩化水素-酢酸エチル、塩化水素-ジオキサン、臭化水素酸、臭化水素-酢酸等により脱保護すると、上記一般式（IV）で表されるアミン、またはアミンの塩が得られる。一方、上記一般式（V）で表されるアミノ酸誘導体のカルボキシル基を、クロル蟻酸イソブチ

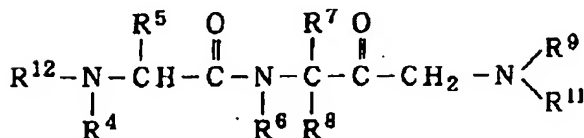
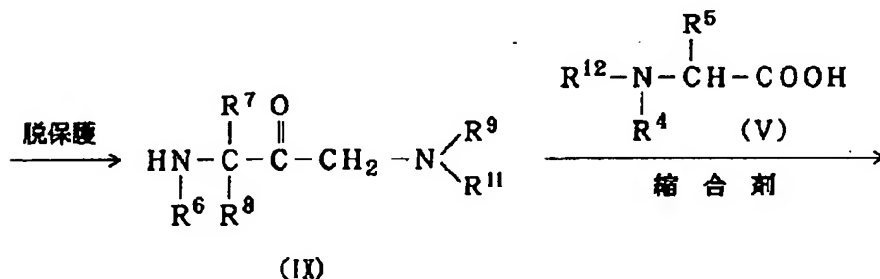
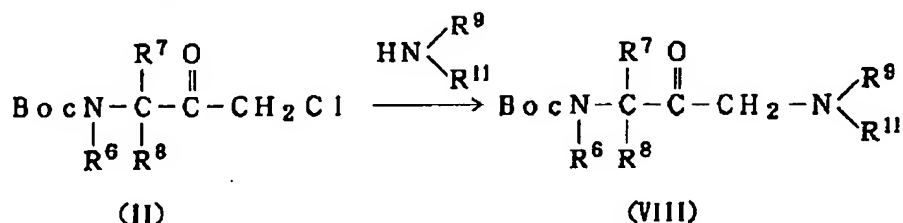
ル、ジフェニルホスホリルアジド、ジシクロヘキシルカルボジイミド、カルボニルジイミダゾール等の縮合剤を用いて活性化し、必要ならトリエチルアミン、ピリジン等の塩基の存在下、上記で得られた化合物 (IV) を反応させることにより、上記一般式 (VI) で表される化合物を得ることができる。さらに化合物 (VI) をクロロホルム、塩化メチレン、メタノール、エタノール、酢酸エチル等に溶解し、メタ過ヨウ素酸ナトリウム、過酸化水

素、過酢酸、メタクロル過安息香酸等を用いてスルフィド基をスルホキシド基あるいはスルホン基に酸化することにより、上記一般式 (VII) で表される化合物が得られる。

【製造法 2】

【0222】

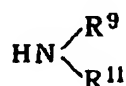
【化15】



【0223】(上記一般式において、~~Boc~~ (X), R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹¹およびR¹²は、既に定義したとおりである。) 上記一般式 (II) で表されるクロロメチルケトン誘導体をジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、酢酸エチル、クロロホルム、塩化メチレン等に溶解し、

【0224】

【化16】

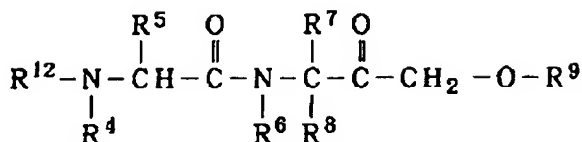
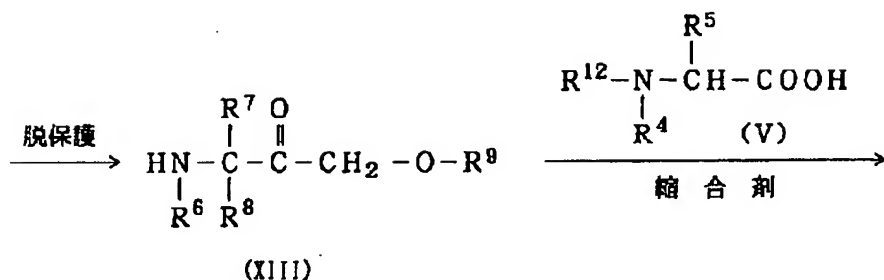
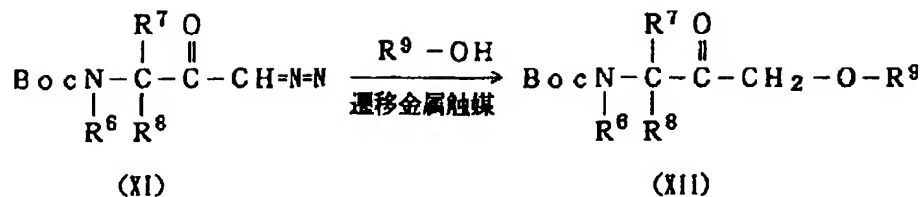


【0225】で表されるアミンを反応させると、上記一般式 (VIII) で表されるジアミノケトン誘導体を得られる。次に製造法 1 と同様の方法により、化合物 (VIII) の Boc 基を脱保護して化合物 (IX) へ導き、さらに上記一般式 (V) で表されるアミノ酸誘導体と縮合させることにより、上記一般式 (X) で表される化合物が得られる。

【製造法 3】

【0226】

【化17】



【0227】（上記一般式において、(Boc)は、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 および R^{12} は、既に定義したとおりである。）

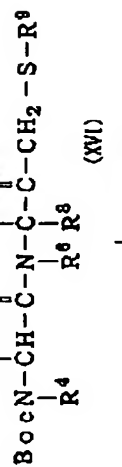
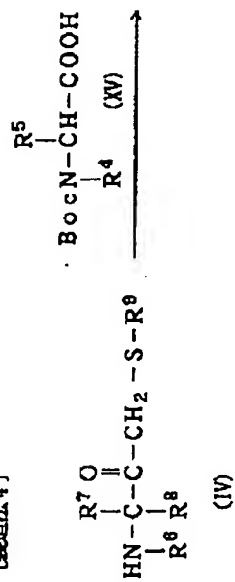
【0228】文献既知の方法（Methods in Enzymology, 80巻, 820ページ, 1981年）を利用して容易に製造できる上記一般式 (XI) で表されるジアゾメチルケトンを経由してクロロホルム、塩化メチレン等の溶媒に溶解し、 CuO 、 $\text{Rh}_2(\text{OAc})_4$ 等の遷移金属触媒の存在下で、 $\text{R}^9 - \text{OH}$ で表されるアルコールを反応させることにより、上記一般式 (XII) で表され

るオキシメチルケトン誘導体を得られる。この場合、クロロホルム、塩化メチレン等の溶媒を用いずに式 (XI) の化合物をアルコール $\text{R}^9 - \text{OH}$ に直接溶かして反応を行うこともできる。次に製造法1と同様の方法により、化合物 (XII) の Boc 基を脱保護して化合物 (XIII) へ導き、さらに上記一般式 (V) で表されるアミノ酸誘導体と縮合させることにより、上記一般式 (XIV) で表される化合物を得られる。

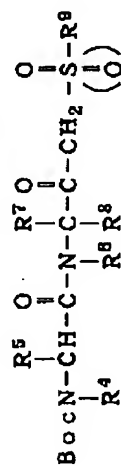
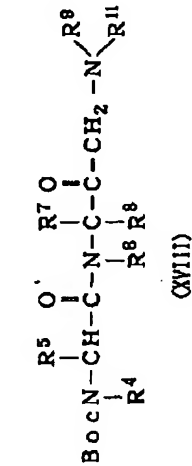
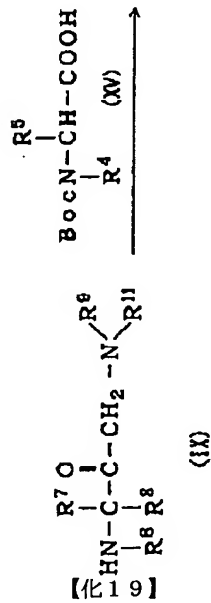
【0229】

【化18】

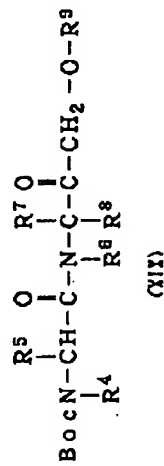
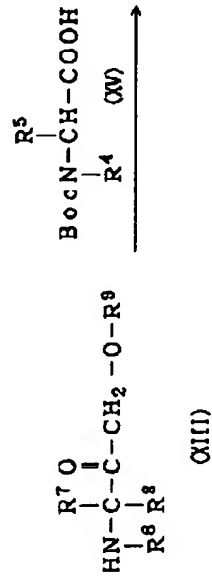
[製造法 4]



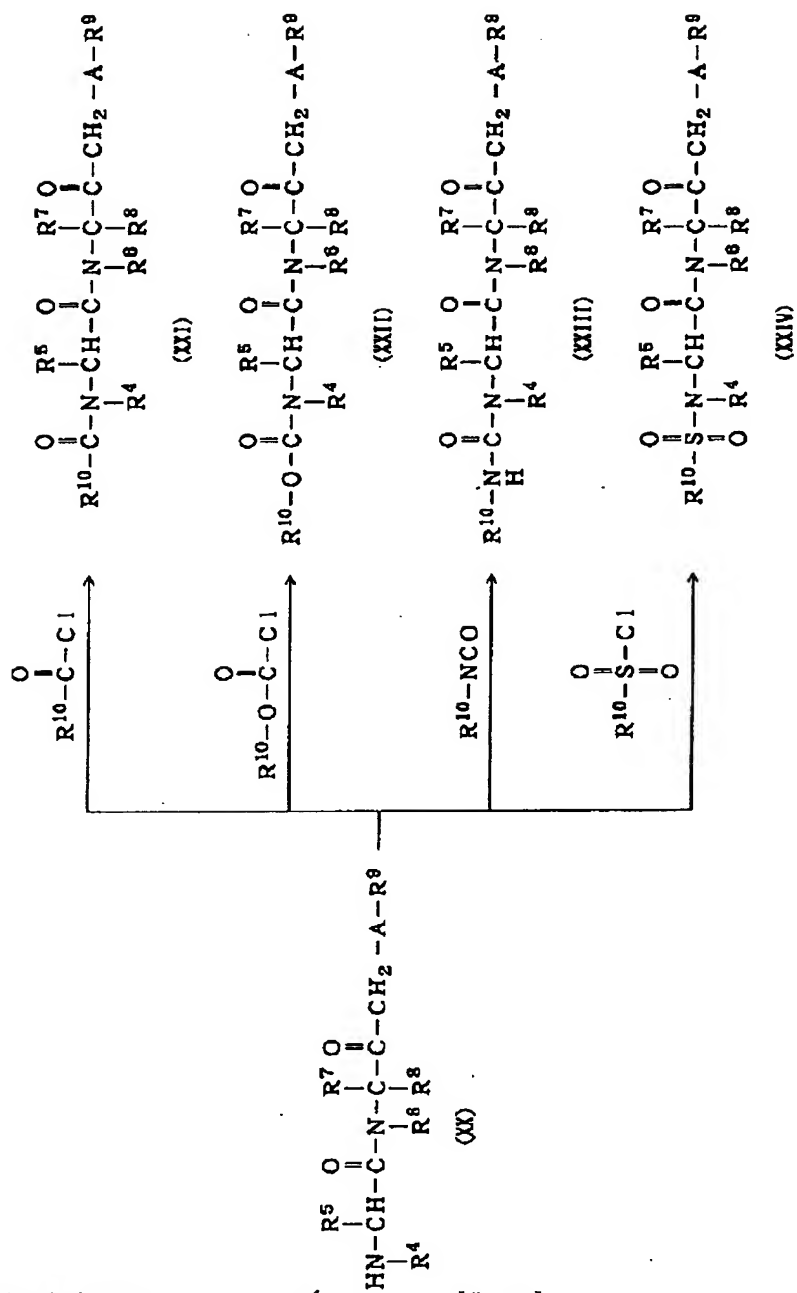
(14X)

[illegible]

(XVII)



(XIX)



【0231】（上記一般式において、Boc、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹およびAは、既に定義したとおりである。）製造法1、製造法2、あるいは製造法3において、式（V）の代わりに式（XV）の化合物を用いて製造される上記一般式（XXI）～（XXIV）で表される化合物のBoc基を、製造法1と同様の方法により脱保護すると、上記一般式（XX）で表される化合物またはその塩が得られる。次に化合物（XX）をクロロホルム、塩化メチレン、酢酸エチル、ジメチルホルムアミド等、通常の有機溶媒に溶かし、トリエチルアミン、ピリジン等のアミンの存在下、

【0232】

【化20】

【0233】で表されるアシルクロリドを反応させると、上記一般式（XXI）で表わされる化合物が得られる。同様に、上記一般式（XX）で表わされる化合物に、

【0234】

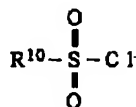
【化21】

【0235】で表されるクロロ酸誘導体を反応させると上記一般式（XXII）で表される化合物が得られ、R¹⁰

-NCOで表されるイソシアナートを反応させると、上記一般式 (XXIII) で表される化合物が得られ、

【0236】

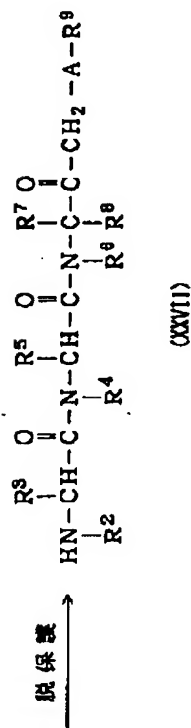
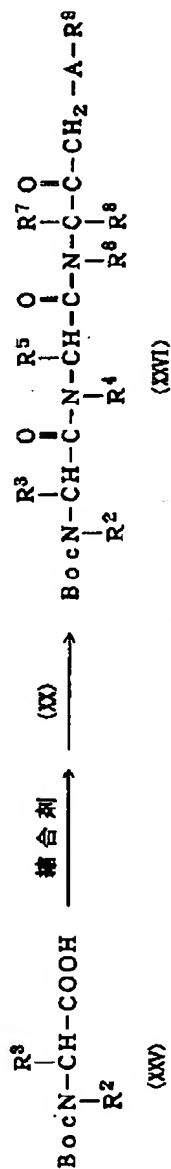
【化22】



【0237】で表されるスルホニルクロリドを反応させると、上記一般式 (XXIV) で表される化合物を得ることができる。

【0238】

【化23】



【製造例5】

【0239】（上記一般式において、 R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 および Boc は既に定義したとおりである。）

【0240】上記一般式 (XXV) で表されるアミノ酸誘導体のカルボキシル基を製造法1で述べた方法と同様にして縮合剤で活性化し、さらに必要に応じて塩基の存在下、上記製造法4で得られた化合物 (XX) を反応させる

と、上記一般式 (XXVI) で表される化合物が得られる。
 (XXVI) 式の化合物を製造法1で述べた方法と同様にして脱保護することにより、一般式 (XXVII) の化合物またはその塩を得ることができる。さらに (XXVII) 式の化合物は製造法4で述べた方法に準じてアミノ基を変換することができる。

【0241】以上述べてきた製造法1、製造法2、製造

法3、製造法4および製造法5の一連の操作において、各化合物内に存在する官能基の保護あるいは脱保護が必要になる場合もあるが、これらの操作は、有機合成反応で通常用いられる一般的な方法を適用することにより、容易に反応を行うことができる。かかる本発明化合物を臨床に応用するに際し、治療上有効な成分の担体成分に対する割合は、1重量%から90重量%の間で変動させる。例えば本発明化合物は顆粒剤、細粒剤、散剤、錠剤、硬カプセル剤、軟カプセル剤、シロップ剤、乳剤、懸濁剤又は液剤等の剤形にして経口投与してもよい、注射剤として静脈内投与、筋肉内投与又は皮下投与してもよい。また、坐剤として用いることもできる。また、注射用の粉末にして用時調製して使用してもよい。経口、経腸、非経口に適した医薬用の有機又は無機の、固体又は液体の担体若しくは希釈剤を本発明薬剤を調製するために用いることができる。固形製剤を製造する際に用いられる賦形剤としては、例えば乳糖、蔗糖、デンプン、タルク、セルロース、デキストリン、カオリン、炭酸カルシウム等が用いられる。経口投与のための液体製剤、即ち、乳剤、シロップ剤、懸濁剤、液剤等は、一般的に用いられる不活性な希釈剤、例えば水又は植物油等を含む。この製剤は、不活性な希釈剤以外に補助剤、例えば湿潤剤、懸濁補助剤、甘味剤、芳香剤、着色剤又は保存剤等を含むことができる。液体製剤にしてゼラチンのような吸収されうる物質のカプセル中に含ませてもよい。非経口投与の製剤、即ち、注射剤、坐剤等の製造に用いられる溶剤又は懸濁化剤としては、例えば水、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ベンジルアルコール、オレイン酸エチル、レシチン等が挙げられる。坐剤に用いられる基剤としては、例えばカカオ脂、乳化カカオ脂、ラウリン脂、ウィテップゾール等が挙げられる。製剤の調製方法は常法によればよい。

【0242】臨床投与量は、経口投与により用いられる場合には、成人に対し本発明の化合物として、一般には、1日量0.01~1000mgあるが、年令、病態、症状により適宜増減することが更に好ましい。前記1日量の発明薬剤は、1日に1回、又は適当な間隔において1日に2若しくは3回に分けて投与してもよいし、間欠投与してもよい。

【0243】また、注射剤として用いる場合には、成人に対し本発明の化合物として、1回量0.001~100mgを連続投与又は間欠投与することが好ましい。

【0244】

【実施例】以下、本発明を参考例及び実施例によりさらに詳しく説明するが、本発明はその要旨を超えない限り、これらの参考例及び実施例によって何ら制限を受けるものではない。

【0245】参考例1 (s)-3-tert-ブトキシカルボニルアミノ-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノンの製造

(s)-3-tert-ブトキシカルボニルアミノ-1-クロル-2-ヘプタノン6.54g及びフルフリルメルカプタン3.11gをテトラヒドロフラン200mlに溶かし、2N水酸化ナトリウム水溶液13mlを加え、室温で17時間攪拌後、重曹水を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗い、硫酸マグネシウムで乾燥後濾過、濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒 10%酢酸エチル含有ヘキサン）で精製し、目的物7.82gを得た。

【0246】収率92%

NMR (CDCl₃, δ): 0.89 (t, J=6.6 Hz, 3H), 1.20~1.95 (m, 6H), 1.44 (s, 9H), 3.28 (d, J=15 Hz, 1H), 3.39 (d, J=15 Hz, 1H), 3.74 (s, 2H), 4.52 (m, 1H), 5.09 (m, 1H), 6.22 (d, J=2.9 Hz, 1H), 6.31 (m, 1H), 7.36 (m, 1H)

【0247】参考例2 (s)-3-アミノ-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン 塩酸塩の製造

参考例1で得られた(s)-3-tert-ブトキシカルボニルアミノ-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン7.8gを酢酸エチル80mlに溶かし、4Nの塩化水素含有酢酸エチル溶液80mlを加え、室温で1時間攪拌した後、ヘキサン100mlを加えた。生成した結晶を濾過し、ヘキサンで洗浄し、目的物5.93gを得た。

【0248】収率93%

NMR (DMSO-d₆, δ): 0.87 (t, J=6.8 Hz, 3H), 1.16~1.40 (m, 4H), 1.63~1.95 (m, 2H), 3.55 (d, J=16 Hz, 1H), 3.70 (d, J=16 Hz, 1H), 3.81 (s, 2H), 4.27 (m, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.41 (m, 1H), 7.61 (m, 1H), 8.29 (m, 3H)

【0249】実施例1 (s)-3-((s)-2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン（表-1の化合物番号43）の製造

参考例2で得られた(s)-3-アミノ-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン塩酸塩5.39g及び(s)-tert-ブトキシカルボニルロイシン N-ヒドロキシコハク酸イミドエステル6.37gを塩化メチレン150mlに溶かし、トリエチルアミン5.4mlを加えて室温で15時間攪拌した後、0.5N塩酸水100mlを加え、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗い、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過、濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒 25%酢酸エチル含有ヘキサン）で精製し、目的物8.49gを得た。

【0250】収率: 96%

IR (neat, cm^{-1}) : 3350, 1700, 1675, 1660

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.90~1.0 (m, 9H), 1.15~1.75 (m, 8H), 1.45 (s, 9H), 1.80~1.95 (m, 1H), 3.26 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.35 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.72 (s, 2H), 4.14 (m, 1H), 4.75 (m, 1H), 4.92 (d, $J=8\text{Hz}$, 1H), 6.22 (d, $J=3.1\text{Hz}$, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.72 (d, $J=7\text{Hz}$, 1H), 7.36 (m, 1H)

【0251】実施例2 (s)-3-(s)-2-アミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン 塩酸塩(表-1の化合物番号62)の製造

実施例1で得られた(s)-3-(s)-2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン8.47gを酢酸エチル25mlに溶かし、4Nの塩化水素含有酢酸エチル溶液25mlを加えた。室温で50分間攪拌した後、ヘキサン50mlを加え、生成した結晶を濾過してヘキサンで洗浄し、目的物4.31gを得た。

【0252】収率:59%

IR (KBr, cm^{-1}) : 3300, 1698, 1670

NMR (CD_3OD , δ) : 0.88~1.18 (m, 9H), 1.27~2.03 (m, 9H), 3.41 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.50 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.79 (s, 2H), 3.98 (m, 1H), 4.75 (dd, $J=4.2\text{Hz}$, 9.3Hz, 1H), 6.28 (d, $J=3.4\text{Hz}$, 1H), 6.37 (m, 1H), 7.46 (m, 1H)

【0253】実施例3 (s)-1-フルフリルチオ-3-(s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノバレリルアミノ)-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号82)の製造

実施例2で得られた(s)-3-(s)-2-アミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン 塩酸塩 4.31gを塩化メチレン100mlに溶かして0℃に冷却し、フェノキシアセチルクロリド2.07g及びトリエチルアミン3.2mlを加えた。0℃で30分間、室温で30分間攪拌した後、0.5N塩酸水50mlを加え、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過、濃縮してからシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒 25%酢酸エチル含有ヘキサン)で精製し、目的物3.96gを得た。

【0254】収率:74%

IR (neat, cm^{-1}) : 3300, 1710, 16

50

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.87 (t, $J=6.7\text{Hz}$, 3H), 0.93 (d, $J=6.0\text{Hz}$, 6H), 1.14~1.40 (m, 4H), 1.48~2.0 (m, 5H), 3.27 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.35 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.53 (s, 2H), 4.56 (m, 1H), 4.74 (m, 1H), 6.23 (m, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.59 (d, $J=7\text{Hz}$, 1H), 6.90~7.10 (m, 4H), 6.25~6.40 (m, 3H)

【0255】実施例4 (s)-1-フルフリルスルフィニル-3-(s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノバレリルアミノ)-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号83)の製造

実施例3で得られた(s)-1-フルフリルチオ-3-(s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノバレリルアミノ)-2-ヘプタノン176mgをメタノール10ml及び水10mlに溶かし、メタ過ヨウ素酸ナトリウム82mgを加えて室温で48時間反応させた後、メタノールを減圧留去し、飽和食塩水を加えた。クロロホルムで抽出し、抽出液を飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過、濃縮してからシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒 ヘキサン:酢酸エチル=1:1)で精製し、目的物66mgを得た。

【0256】収率:37%

融点:96~99℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3320, 1720, 1690, 1650

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.78~1.07 (m, 9H), 1.15~2.05 (m, 9H), 3.34~3.70 (m, 1H), 4.05~4.78 (m, 7H), 6.40 (m, 1H), 6.47 (m, 1H), 6.80~7.18 (m, 5H), 7.20~7.40 (m, 2H), 7.43 (m, 1H)

【0257】実施例5 (s)-1-フルフリルスルホニル-3-(s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノバレリルアミノ)-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号84)の製造

実施例3で得られた(s)-1-フルフリルチオ-3-(s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノバレリルアミノ)-2-ヘプタノン150mgを塩化メチレン3mlに溶かして0℃に冷却、メタクロ過安息香酸177mgを加えた。0℃で30分、室温で10時間反応させた後、10%炭酸カリウム水溶液を加えた。塩化メチレンで抽出し、抽出液を飽和食塩水で洗浄してから硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過、濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒 ヘキサン:酢酸エチル=2:1)で精製し、目的物130mgを得

た。

【0258】収率：80%

融点：120～121℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3300, 1730, 1650

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.80～1.0 (m, 9H), 1.15～2.05 (m, 9H), 3.97

(d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 4.28 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 4.40～4.63 (m, 6H), 6.42 (m, 1H), 6.58 (m, 1H), 6.82～6.99 (m, 4H), 7.04 (t, $J=7$, 4H), 7.22～7.40 (m, 2H), 7.48 (m, 1H)

【0259】実施例6 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルオキシ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号452)の製造

N-ベンジロキシカルボニル-L-ロイシル-L-フェニルアラニン ジアゾメチルケトン314mgをフルフリルアルコール2ml及び塩化メチレン1mlに溶かし、酢酸ロジウム(II)二量体10mgを加えた。室温で1時間攪拌した後、溶媒を減圧留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒 ヘキサン-酢酸エチル)で精製し、目的物27mgを得た。

【0260】収率：7.4%

融点：94～95℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3314, 3285, 1738, 1692, 1653

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.89 (d, $J=6.0\text{Hz}$, 6H), 1.35～1.70 (m, 3H), 2.94 (dd, $J=14\text{Hz}$, 6.2Hz, 1H), 3.10 (dd, $J=14\text{Hz}$, 6.5Hz, 1H), 3.97 (d, $J=17\text{Hz}$, 1H), 4.12 (m, 1H), 4.15 (d, $J=17\text{Hz}$, 1H), 4.44 (d, $J=13\text{Hz}$, 1H), 4.53 (d, $J=13\text{Hz}$, 1H), 4.90～5.05 (m, 2H), 5.09 (s, 2H), 6.28～6.43 (m, 2H), 6.51 (d, $J=7.0\text{Hz}$, 1H), 7.08 (d, $J=7.1\text{Hz}$, 2H), 7.17～7.30 (m, 3H), 7.35 (s, 5H), 7.41 (m, 1H)

参考例1および2ならびに実施例1, 2, 3, 4, 5および6と同様の操作を行ない、次の化合物を製造した。以下にそれらの物性値を示す。

【0261】実施例7 1-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-3-フルフリルチオ-2-プロパノン(表-1の化合物番号2)の製造

融点：59～62℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3340, 1730, 169

2, 1648

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.94 (d, $J=6.0\text{Hz}$, 6H), 1.48～1.77 (m, 3H), 3.24 (s, 2H), 3.72 (s, 2H), 4.10～4.35 (m, 3H), 4.95～5.11 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 6.21 (d, $J=3.1\text{Hz}$, 1H), 6.32 (m, 1H), 6.63 (m, 1H), 7.15～7.38 (m, 6H)

【0262】実施例8 1-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-3-(3-ピリジルメチルチオ)-2-プロパノン(表-1の化合物番号5)の製造

IR (neat, cm^{-1}) : 3306, 1717, 1666

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.93 (d, $J=5.8\text{Hz}$, 6H), 1.42～1.79 (m, 3H), 3.10 (s, 2H), 3.66 (s, 2H), 4.25 (d, $J=4.7\text{Hz}$, 2H), 4.28 (m, 1H), 5.11 (s, 2H), 5.50 (d, $J=8.2\text{Hz}$, 1H), 6.93 (m, 1H), 7.18～7.42 (m, 6H), 7.65 (d, $J=7.8\text{Hz}$, 1H), 8.42～8.60 (m, 2H)

【0263】実施例9 3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-3-メチル-2-ブタノン(表-1の化合物番号15)の製造

融点：80～82℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3275, 1728, 1684, 1651

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.92 (d, $J=5.8\text{Hz}$, 3H), 0.93 (d, $J=6.2\text{Hz}$, 3H), 1.44 (s, 3H), 1.46 (s, 3H), 1.57～1.77 (m, 3H), 3.37 (s, 2H), 3.77 (s, 2H), 4.13 (m, 1H), 5.10 (s, 2H), 6.23 (d, $J=3.2\text{Hz}$, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.66 (s, 1H), 7.32～7.42 (m, 6H)

【0264】実施例10 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-メチル-2-ペンタノン(表-1の化合物番号22)の製造

IR (neat, cm^{-1}) : 3300, 1720, 1705, 1660

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.79 (d, $J=6.8\text{Hz}$, 3H), 0.92 (d, $J=6.8\text{Hz}$, 3H), 0.93 (d, $J=5.0\text{Hz}$, 6H), 1.42～1.77 (m, 3H), 2.20 (m, 1H), 3.24 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.31 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.70 (s, 2H), 4.25 (m, 1H), 4.78 (dt, $J=8.9\text{Hz}$,

4. 6 Hz, 1H), 5. 10 (s, 2H), 5. 39 (d, J=7. 4 Hz, 1H), 6. 21 (d, J=2. 8 Hz, 1H), 6. 28 (m, 1H), 6. 73 (d, J=8. 9 Hz, 1H), 7. 32 (s, 5H), 7. 35 (m, 1H)

【0265】実施例11 (s)-1-フルフリルチオ-4-メチル-3-((s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノバレリルアミノ)-2-ペンタノン(表-1の化合物番号24)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1720, 1710, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 82 (d, J=6. 9 Hz, 3H), 0. 91~0. 96 (m, 9H), 1. 49~1. 82 (m, 3H), 2. 23 (m, 1H), 3. 26 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 34 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 72 (s, 2H), 4. 53 (s, 2H), 4. 60 (m, 1H), 4. 78 (dt, J=8. 8 Hz, 4. 5 Hz, 1H), 6. 23 (d, J=2. 7 Hz, 1H), 6. 30 (m, 1H), 6. 75 (d, J=8. 7 Hz, 1H), 6. 90~6. 99 (m, 3H), 7. 03 (m, 1H), 7. 25~7. 40 (m, 3H)

【0266】実施例12 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘキサノン(表-1の化合物番号28)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3350, 1710, 1655

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 89 (t, J=7. 2 Hz, 3H), 0. 94 (d, J=6. 2 Hz, 6H), 1. 15~1. 95 (m, 7H), 3. 24 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 31 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 71 (s, 2H), 4. 21 (m, 1H), 4. 75 (m, 1H), 5. 11 (s, 2H), 5. 21 (d, J=8 Hz, 1H), 6. 22 (d, J=2. 9 Hz, 1H), 6. 28 (m, 1H), 6. 65 (m, 1H), 7. 30~7. 35 (m, 6H)

【0267】実施例13 (s)-1-フルフリルチオ-3-((s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノバレリルアミノ)-2-ヘキサノン(表-1の化合物番号30)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1720, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 78~1. 05 (m, 9H), 1. 17~1. 95 (m, 7H), 3. 27 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 34 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 72 (s, 2H), 4. 53 (m, 1H), 4. 55 (s, 2H), 4. 75 (m, 1H), 6. 23 (d, J=3. 0 Hz, 1H), 6. 3

0 (m, 1H), 6. 58 (d, J=10 Hz, 1H), 6. 85~7. 15 (m, 3H), 7. 23~7. 37 (m, 4H)

【0268】実施例14 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-5-メチル-1-メチルチオ-2-ヘキサノン(表-1の化合物番号32)の製造

融点: 96~97℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3220, 1725, 1693, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 93~1. 0 (m, 12H), 1. 35~1. 75 (m, 6H), 2. 06 (s, 3H), 3. 20 (d, J=14 Hz, 1H), 3. 48 (d, J=14 Hz, 1H), 4. 19 (m, 1H), 4. 84 (m, 1H), 5. 11 (s, 2H), 5. 17 (m, 1H), 6. 48 (d, J=7 Hz, 1H), 7. 35 (s, 5H)

【0269】実施例15 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-5-メチル-2-ヘキサノン(表-1の化合物番号35)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1710, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 92 (d, J=5. 0 Hz, 6H), 0. 94 (d, J=5. 0 Hz, 6H), 1. 38~1. 79 (m, 6H), 3. 25 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 33 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 71 (s, 2H), 4. 19 (m, 1H), 4. 77 (dddd, J=6. 7 Hz, 6. 7 Hz, 2. 2 Hz, 1H), 5. 11 (s, 2H), 5. 15 (d, J=6. 7 Hz, 1H), 6. 22 (d, J=2. 5 Hz, 1H), 6. 29 (m, 1H), 6. 49 (d, J=6. 7 Hz, 0. 5 Hz), 6. 59 (d, J=6. 7 Hz, 0. 5 Hz), 7. 27~7. 40 (m, 6H)

【0270】実施例16 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-メチルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号37)の製造

融点: 80~82℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3320, 1720, 1685, 1643

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 83~1. 0 (m, 9H), 1. 18~2. 05 (m, 9H), 2. 07 (s, 3H), 3. 20 (d, J=14 Hz, 1H), 3. 36 (d, J=14 Hz, 1H), 4. 23 (m, 1H), 4. 84 (m, 1H), 5. 12 (s, 2H), 5. 16 (m, 1H), 6. 56 (d, J=8 Hz, 1H), 7. 35 (s, 5H)

【0271】実施例17 (s)-3-ベンジロキシカ

ルボニルアミノアセチルアミノ-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号38) の製造

IR (neat, cm^{-1}) : 3350, 1720, 1715, 1670

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.87 (d, $J=6.7$ Hz, 3H), 1.12~1.40 (m, 4H), 1.55 (m, 1H), 1.85 (m, 1H), 3.26 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.34 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 3.90 (d, $J=4.3$ Hz, 2H), 4.81 (m, 1H), 5.13 (s, 2H), 5.54 (m, 1H), 6.21 (d, $J=3.2$ Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.72 (d, $J=7.0$ Hz, 1H), 7.27~7.41 (m, 6H)

【0272】実施例18 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノプロピオニルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号39) の製造

融点: 85~87°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3300, 1730, 1690, 1660

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.87 (d, $J=6.8$ Hz, 3H), 1.15~1.37 (m, 3H), 1.39 (d, $J=7.0$ Hz, 3H), 1.45~1.75 (m, 2H), 1.87 (m, 1H), 3.26 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.33 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.26 (m, 1H), 4.75 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 5.32 (m, 1H), 6.22 (d, $J=3.2$ Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.61 (m, 1H), 7.30~7.36 (m, 6H)

【0273】実施例19 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-3-メチルブチルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号40) の製造

融点: 115~116°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3280, 1715, 1690, 1630

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.86 (t, $J=7.0$ Hz, 3H), 0.92 (d, $J=6.8$ Hz, 3H), 0.97 (d, $J=6.8$ Hz, 3H), 1.15~1.39 (m, 4H), 1.53 (m, 1H), 1.89 (m, 1H), 2.14 (m, 1H), 3.27 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.35 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.02 (d, $J=8.2$ Hz, 6.1 Hz, 1H), 4.78 (m, 1H), 5.11 (s, 2H), 5.38 (d, $J=8.2$ Hz, 1H), 6.21 (d, $J=2.6$ Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.56 (d, $J=7.7$ Hz, 1H), 7.27~7.42 (m, 6H)

H)

【0274】実施例20 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号41) の製造

融点: 95~96°C

IR (KBr, cm^{-1}) : 3280, 3260, 1690, 1680, 1640

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.86 (t, $J=7.0$ Hz, 3H), 0.93 (t, $J=7.2$ Hz, 3H), 1.16~1.47 (m, 6H), 1.50~1.67 (m, 2H), 1.75~1.97 (m, 2H), 3.27 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.33 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.19 (m, 1H), 4.77 (m, 2H), 5.11 (s, 2H), 5.30 (d, $J=7.1$ Hz, 1H), 6.21 (d, $J=3.1$ Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.59 (d, $J=7.1$ Hz, 1H), 7.37~7.43 (m, 6H)

【0275】実施例21 (s)-3-((s)-2-シクロヘキシルメトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号46) の製造

IR (neat, cm^{-1}) : 3330, 1715, 1660

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.93 (t, $J=6.9$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J=3.9$ Hz, 6H), 1.10~2.0 (m, 20H), 3.26 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.34 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 3.87 (d, $J=6.4$ Hz, 2H), 4.13 (m, 1H), 4.74 (m, 1H), 5.0 (d, $J=6.4$ Hz, 1H), 6.21 (d, $J=2.6$ Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.60 (d, $J=8$ Hz, 1H), 7.35 (m, 1H)

【0276】実施例22 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号48) の製造

IR (neat, cm^{-1}) : 3300, 1710, 1655

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.87 (t, $J=6.8$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J=5.9$ Hz, 6H), 1.15~2.0 (m, 9H), 3.26 (d, $J=14$ Hz, 1H), 3.33 (d, $J=14$ Hz, 1H), 3.72 (s, 2H), 4.20 (m, 1H), 4.75 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 5.13 (m, 1H), 6.22 (m, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.55 (d, $J=7$ Hz, 1H), 7.26~7.45 (m, 6H)

【0277】実施例23 (s)-3-[(s)-2-(2-フルオロベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号49)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3320, 1710, 1655

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, $J=5.8$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J=5.6$ Hz, 6H), 1.07~2.0 (m, 9H), 3.25 (d, $J=14$ Hz, 1H), 3.32 (d, $J=14$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.13 (m, 1H), 4.75 (m, 1H), 5.05~5.27 (m, 3H), 6.22 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.53 (d, $J=9$ Hz, 1H), 6.98~7.19 (m, 2H), 7.21~7.43 (m, 3H)

【0278】実施例24 (s)-3-[(s)-2-(4-フルオロベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号51)の製造

融点: 67~68°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3400, 3250, 1725, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, $J=7.2$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J=5.0$ Hz, 6H), 1.10~2.0 (m, 9H), 3.27 (d, $J=14$ Hz, 1H), 3.37 (d, $J=14$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.17 (m, 1H), 4.76 (m, 1H), 5.07 (s, 2H), 5.15 (d, $J=7$ Hz, 1H), 6.22 (d, $J=2.9$ Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.50 (d, $J=7$ Hz, 1H), 7.05 (t, $J=8.6$ Hz, 2H), 7.30~7.45 (m, 3H)

【0279】実施例25 (s)-3-[(s)-2-(2-シアノベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号56)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3281, 1766, 1712, 1658

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85~1.06 (m, 9H), 1.25~1.43 (m, 4H), 1.52~1.83 (m, 3H), 1.83~2.02 (m, 2H), 3.24 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.33 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.67 (s, 2H), 4.56 (m, 1H), 4.77 (m, 1H), 5.33 (s, 2H), 6.17 (d, $J=3.1$ Hz, 1H), 6.23 (m, 1H), 6.25 (d, $J=8.3$ Hz, 1H), 7.28 (dd, $J=6.4$ Hz, 5.3 Hz, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.43~7.65 (m, 3H), 7.90 (d, $J=7.3$ Hz, 1H)

z, 1H)

【0280】実施例26 (s)-3-[(s)-2-(3-シアノベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号57)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3400, 3250, 2220, 1710, 1630

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, $J=6.6$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J=5.3$ Hz, 6H), 1.09~1.39 (m, 4H), 1.42~1.77 (m, 4H), 1.89 (m, 1H), 3.26 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.34 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.19 (m, 1H), 4.77 (m, 1H), 5.13 (s, 2H), 5.25 (d, $J=7.8$ Hz, 1H), 6.21 (d, $J=3.1$ Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.61 (d, $J=7.3$ Hz, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.51~7.63 (m, 2H)

【0281】実施例27 (s)-3-[(s)-2-(4-シアノベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号58)の製造

融点: 83~89°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3400, 3270, 2220, 1720, 1700, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.86 (t, $J=7.0$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J=6.2$ Hz, 6H), 1.13~1.40 (m, 3H), 1.43~1.79 (m, 5H), 1.79~1.99 (m, 1H), 3.26 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.30 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.72 (s, 2H), 4.19 (m, 1H), 4.77 (m, 1H), 5.16 (s, 2H), 5.32 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 6.21 (d, $J=2.9$ Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.55 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.44 (d, $J=8.3$ Hz, 2H), 7.65 (d, $J=8.3$ Hz, 2H)

【0282】実施例28 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2-ピリジリメトキシカルボニルアミノ)パレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号59)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3350, 1715, 1660

NMR (CDCl_3 , δ): 0.86 (t, $J=6.7$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J=3.8$ Hz, 6H), 1.07~1.99 (m, 9H), 3.27 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.32 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.22 (m,

1H), 4.77 (m, 1H), 5.24 (s, 2H), 5.32 (d, J=8Hz, 1H), 6.21 (d, J=3.2Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.63 (d, J=7Hz, 1H), 7.20~7.40 (m, 3H), 7.69 (m, 1H), 8.58 (d, J=3.1Hz, 1H)

【0283】実施例29 (s)-3-((s)-2-シクロヘキシルカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号65)の製造

融点: 109℃(分解)

IR (KBr, cm^{-1}): 3294, 1707, 1637

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, J=7.0Hz, 3H), 0.98 (d, J=6.7Hz, 3H), 0.99 (d, J=6.7Hz, 3H), 1.11~1.75 (m, 13H), 1.75~1.99 (m, 6H), 2.10 (m, 1H), 3.26 (d, J=15Hz, 1H), 3.30 (d, J=15Hz, 1H), 3.72 (s, 2H), 4.47 (m, 1H), 4.71 (m, 1H), 5.90 (d, J=8.1Hz, 1H), 6.21 (d, J=2.6Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.81 (d, J=7.6Hz, 1H), 7.36 (m, 1H)

【0284】実施例30 (s)-1-フルフリルチオ-3-((s)-4-メチル-2-フェニルアセチルアミノパレリルアミノ)-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号66)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3260, 1710, 1635

NMR (CDCl_3 , δ): 0.75~1.07 (m, 9H), 1.13~1.99 (m, 9H), 3.20~3.38 (m, 2H), 3.59 (s, 2H), 3.71 (s, 2H), 4.43 (m, 1H), 4.68 (m, 1H), 5.78 (d, J=8Hz, 1H), 6.21 (d, J=3.2Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.62 (d, J=7.4Hz, 1H), 7.16~7.40 (m, 6H)

【0285】実施例31 (s)-3-[(s)-2-(4-フルオロフェニルアセチルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号69)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1715, 1660, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.76~0.97 (m, 9H), 1.07~1.96 (m, 9H), 3.20~3.35 (m, 2H), 3.55 (d, J=4.3Hz, 2H), 3.71 (s, 2H), 4.46 (m, 1H), 4.71 (m, 1H), 5.85 (d, J=7Hz, 1H), 6.20 (d, J=3.0Hz, 1H),

6.29 (m, 1H), 6.59 (d, J=6Hz, 0.6H), 6.69 (d, J=6Hz, 0.4H), 7.03 (t, J=8.6Hz, 2H), 7.17~7.35 (m, 3H)

【0286】実施例32 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2,3-メチレンジオキシフェニルアセチルアミノ)パレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号73)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3280, 1720, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.80~1.0 (m, 9H), 1.13~1.98 (m, 9H), 3.20~3.37 (m, 2H), 3.55 (d, J=3.9Hz, 2H), 3.71 (s, 2H), 4.44 (m, 1H), 4.70 (m, 1H), 5.90~6.07 (m, 3H), 6.21 (d, J=3.1Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.65 (d, J=7Hz, 1H), 6.70~6.93 (m, 3H), 7.35 (m, 1H)

【0287】実施例33 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(1-ナフチルアセチルアミノ)パレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号76)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1710, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.70 (d, J=6.5Hz, 3H), 0.72 (d, J=6.5Hz, 3H), 0.85 (t, J=7.2Hz, 3H), 1.05~1.91 (m, 9H), 3.20~3.38 (m, 2H), 3.70 (s, 2H), 4.02 (d, J=1.1Hz, 1H), 4.10 (d, J=1.1Hz, 1H), 4.39 (m, 1H), 4.63 (m, 1H), 5.59 (d, J=8Hz, 1H), 6.21 (d, J=2.9Hz, 1H), 6.36 (m, 1H), 6.55 (d, J=7Hz, 0.5H), 6.62 (d, J=7Hz, 0.5H), 7.30~7.61 (m, 5H), 7.80~8.0 (m, 3H)

【0288】実施例34 (s)-3-[(s)-2-(3-ベンゾチエニルアセチルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号79)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1715, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.71~1.0 (m, 9H), 1.07~1.97 (m, 9H), 3.24 (d, J=3.7Hz, 0.7H), 3.27 (d, J=3.0Hz, 1.3H), 3.70 (s, 1.3H), 3.71 (s, 0.7H), 3.84 (s, 1.3H), 3.85 (s, 0.7H), 4.40 (m, 1H), 4.67 (m, 1H), 5.91 (m, 1H),

6. 20 (d, J=3. 2 Hz, 1H), 6. 29 (m, 1H), 6. 57 (d, J=6 Hz, 0. 7 H), 6. 70 (d, J=6 Hz, 0. 3H), 7. 34~7. 45 (m, 4H), 7. 71 (m, 1H), 7. 87 (m, 1H)

【0289】実施例35 (s)-3-[(s)-2-シクロヘキシルオキシアセチルアミノ-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号81) の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3400, 3300, 1715, 1665

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 80~1. 0 (m, 11H), 1. 10~1. 99 (m, 17H), 3. 29~3. 40 (m, 3H), 3. 71 (s, 0. 7H), 3. 72 (s, 1. 3H), 3. 98 (d, J=1. 0 Hz, 1. 3H), 3. 99 (s, 0. 7H), 4. 50 (m, 1H), 4. 74 (m, 1H), 6. 22 (d, J=2. 7 Hz, 1H), 6. 30 (m, 1H), 6. 70 (d, J=7 Hz, 0. 7H), 6. 77 (d, J=7 Hz, 0. 3H), 6. 92 (d, J=8 Hz, 1H), 7. 35 (m, 1H)

【0290】実施例36 (s)-3-[(s)-2-(2-フルオロフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号85) の製造

融点: 60~62℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 1715, 1670, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 87 (t, J=7. 0 Hz, 3H), 0. 95 (d, J=6. 1 Hz, 6H), 1. 10~1. 99 (m, 9H), 3. 26 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 34 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 72 (s, 2H), 4. 53 (m, 1H), 4. 57 (s, 2H), 4. 75 (m, 1H), 6. 22 (d, J=2. 8 Hz, 1H), 6. 29 (m, 1H), 6. 65 (d, J=8 Hz, 1H), 6. 90~7. 20 (m, 5H), 7. 36 (m, 1H)

【0291】実施例37 (s)-3-[(s)-2-(3-フルオロフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号86) の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1750, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 87 (t, J=7. 2 Hz, 3H), 0. 93 (d, J=6. 3 Hz, 6H), 1. 15~2. 0 (m, 9H), 3. 20~3. 40 (m, 2H), 3. 71 (d, J=6. 4 Hz, 2H), 4. 51 (d, J=2. 2 Hz, 2H), 4. 61 (m, 1H), 4. 76 (m, 1H), 6. 21

(d, J=3. 1 Hz, 1H), 6. 28 (m, 1H), 6. 62~6. 79 (m, 3H), 6. 81~7. 10 (m, 2H), 7. 18~7. 39 (m, 2H)

【0292】実施例38 (s)-3-[(s)-2-(4-フルオロフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号87) の製造

融点: 88~91℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1700, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 86 (t, J=7. 0 Hz, 3H), 0. 93 (d, J=5. 7 Hz, 6H), 1. 10~2. 0 (m, 9H), 3. 21~3. 32 (m, 2H), 3. 71 (d, J=5. 6 Hz, 2H), 4. 48 (d, J=2. 7 Hz, 2H), 4. 59 (m, 1H), 4. 76 (m, 1H), 6. 20 (d, J=3. 1 Hz, 1H), 6. 27 (m, 1H), 6. 65 (m, 1H), 6. 78~7. 10 (m, 5H), 7. 30~7. 42 (m, 1H)

【0293】実施例39 (s)-3-[(s)-2-(2-クロロフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号88) の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3320, 1715, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 85 (t, J=3. 9 Hz, 3H), 0. 92~1. 05 (m, 6H), 1. 15~1. 98 (m, 9H), 3. 27 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 35 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 71 (s, 2H), 4. 54 (s, 2H), 4. 52 (m, 1H), 4. 75 (m, 1H), 6. 22 (m, 1H), 6. 29 (m, 1H), 6. 79~7. 05 (m, 3H), 7. 17~7. 31 (m, 2H), 7. 33~7. 45 (m, 2H)

【0294】実施例40 (s)-3-[(s)-2-(4-クロロフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号90) の製造

融点: 66~67℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3320, 1710, 1645

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 87 (t, J=6. 9 Hz, 3H), 0. 92 (d, J=7. 4 Hz, 6H), 1. 07~1. 99 (m, 9H), 3. 23~3. 38 (m, 2H), 3. 72 (d, J=5. 0 Hz, 2H), 4. 50 (d, J=3. 2 Hz, 2H), 4. 53 (m, 1H), 4. 76 (m, 1H), 6. 20 (m, 1H), 6. 28 (m, 1H), 6. 57 (d, J=8 Hz, 0. 5H), 6. 70 (d, J=8

Hz, 0.5H), 6.79~6.99 (m, 4H), 7.29 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.36 (m, 1H)

【0295】実施例41 (s)-3-[(s)-2-(2,3-ジクロロフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号91)の製造

融点: 79~80℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1715, 1660, 1645

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, J=7.0 Hz, 3H), 0.94 (d, J=5.2 Hz, 3H), 0.96 (d, J=5.5 Hz, 3H), 1.10~2.0 (m, 9H), 3.23~3.40 (m, 2H), 3.72 (d, J=3.6 Hz, 2H), 4.51 (m, 1H), 4.57 (s, 2H), 4.75 (m, 1H), 6.21 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.58 (d, J=7 Hz, 0.7H), 6.70 (d, J=7 Hz, 0.3H), 6.82 (m, 1H), 7.10~7.22 (m, 3H), 7.35 (d, J=1.9 Hz, 1H)

【0296】実施例42 (s)-3-[(s)-2-(2,4-ジクロロフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号92)の製造

融点: 107~108℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1715, 1660, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, J=7.1 Hz, 3H), 0.93~0.98 (m, 6H), 1.05~1.99 (m, 9H), 3.27 (d, J=14 Hz, 1H), 3.36 (d, J=14 Hz, 1H), 3.70 (s, 0.4H), 3.72 (s, 1.6H), 4.52 (m, 1H), 4.54 (s, 2H), 4.78 (m, 1H), 6.21 (d, J=3.1 Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.58 (d, J=7 Hz, 0.8H), 6.70 (d, J=7 Hz, 0.2H), 6.84 (d, J=9 Hz, 1H), 7.08~7.50 (m, 4H)

【0297】実施例43 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2,4,6-トリクロロフェノキシアセチルアミノ)バレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号94)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1710, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.82~0.89 (m, 3H), 0.92~1.10 (m, 6H), 1.17~2.0 (m, 9H), 3.22~3.40 (m, 2H), 3.70 (s, 0.4H), 3.72 (s, 1.6H), 4.51 (d, J=1.6 Hz, 2H), 4.

63 (m, 1H), 4.76 (m, 1H), 6.21 (d, J=2.6 Hz, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.83 (d, J=7 Hz, 0.8H), 6.92 (d, J=7 Hz, 0.2H), 7.23~7.40 (m, 4H)

【0298】実施例44 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2-メチルフェノキシアセチルアミノ)バレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号96)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1710, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, J=6.9 Hz, 3H), 0.94 (d, J=6.1 Hz, 6H), 1.07~1.97 (m, 9H), 2.30 (s, 3H), 3.19~3.39 (m, 2H), 3.71 (d, J=4.6 Hz, 2H), 4.53 (d, J=1.8 Hz, 2H), 4.54 (m, 1H), 4.76 (m, 1H), 6.22 (m, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.55~6.82 (m, 2H), 6.87~7.03 (m, 2H), 7.11~7.21 (m, 2H), 7.30~7.40 (m, 1H)

【0299】実施例45 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(3-メチルフェノキシアセチルアミノ)バレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号97)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1710, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.78~1.01 (m, 9H), 1.05~1.95 (m, 9H), 2.33 (s, 3H), 3.21~3.38 (m, 2H), 3.70 (s, 1.3H), 3.72 (s, 0.7H), 4.50 (s, 0.7H), 4.51 (s, 1.3H), 4.56 (m, 1H), 4.73 (m, 1H), 6.20 (m, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.58~6.80 (m, 3H), 6.84 (d, J=6.9 Hz, 1H), 6.92 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.19 (t, J=7.7 Hz, 1H), 7.35 (m, 1H)

【0300】実施例46 (s)-3-[(s)-2-(4-クロロ-2-メチルフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号100)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1715, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.86 (t, J=7.0 Hz, 3H), 0.95 (d, J=5.3 Hz, 6H), 1.19~1.99 (m, 9H), 2.25 (s, 3H), 3.22~3.38 (m, 2H), 3.71 (d, J=5.9 Hz, 2H), 4.49 (s, 2H), 4.60 (q, J=7.6 Hz, 1H), 4.7

8 (m, 1H), 6.20 (m, 1H), 6.27 (m, 1H), 6.63~6.80 (m, 1.5H), 6.82~7.20 (m, 3.5H), 7.35 (m, 1H)

【0301】実施例47 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-2-(2-メトキシフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号102)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1710, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85 (t, $J=7.1$ Hz, 3H), 0.91 (d, $J=6.2$ Hz, 3H), 0.93 (d, $J=6.2$ Hz, 3H), 1.07~1.37 (m, 5H), 1.42~1.63 (m, 2H), 1.63~1.95 (m, 2H), 3.25 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.33 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 3.88 (s, 3H), 4.50 (m, 1H), 4.56 (s, 2H), 4.70 (m, 1H), 6.22 (d, $J=2.9$ Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.74 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 6.84~7.0 (m, 3H), 7.05 (m, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.47 (d, $J=8.0$ Hz, 1H)

【0302】実施例48 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-2-(4-メトキシフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号104)の製造

融点: 86~88°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3302, 3261, 1712, 1668, 1637

NMR (CDCl_3 , δ): 0.86 (t, $J=6.9$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J=6.0$ Hz, 6H), 1.17~1.39 (m, 4H), 1.45~1.78 (m, 4H), 1.89 (m, 1H), 3.27 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.35 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 3.77 (s, 3H), 4.43 (d, $J=10$ Hz, 1H), 4.48 (d, $J=10$ Hz, 1H), 4.61 (m, 1H), 4.74 (m, 1H), 6.22 (d, $J=3.1$ Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.80~6.91 (m, 5H), 7.01 (d, $J=8.4$ Hz, 1H), 7.36 (m, 1H)

【0303】実施例49 (s)-1-フルフリルチオ-3-((s)-4-メチル-2-フェニルチオアセチルアミノバレリルアミノ)-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号107)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1715, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.78~1.05 (m, 9H), 1.15~2.05 (m, 9H), 3.18~

3.27 (m, 2H), 3.57~3.75 (m, 4H), 4.50 (m, 1H), 4.69 (m, 1H), 6.21 (d, $J=2.4$ Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.68 (d, $J=8$ Hz, 0.4H), 6.81 (d, $J=8$ Hz, 0.6H), 7.08~7.40 (m, 7H)

【0304】実施例50 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(3-フェノキシピロピオニルアミノ)バレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号109)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1715, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83 (t, $J=6.8$ Hz, 3H), 0.90~0.94 (m, 6H), 1.10~1.99 (m, 9H), 2.66 (t, $J=5.9$ Hz, 1H), 2.69 (t, $J=5.9$ Hz, 1H), 3.20~3.38 (m, 2H), 3.68 (s, 1.3H), 3.70 (s, 0.7H), 4.25 (t, $J=5.9$ Hz, 2H), 4.55 (m, 1H), 4.70 (m, 1H), 6.20 (d, $J=3.3$ Hz, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.52 (d, $J=7$ Hz, 1H), 6.80~7.01 (m, 4H), 7.20~7.40 (m, 3H)

【0305】実施例51 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1-ナフトキシアセチルアミノ)バレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号111)の製造

NMR (CDCl_3 , δ): 0.80~1.08 (m, 9H), 1.15~2.0 (m, 13H), 2.67~2.80 (m, 4H), 3.21~3.40 (m, 2H), 3.71 (d, $J=7.3$ Hz, 2H), 4.49 (s, 2H), 4.60 (m, 1H), 4.76 (q, $J=4.6$ Hz, 1H), 6.20 (m, 1H), 6.27 (m, 1H), 6.58 (d, $J=8$ Hz, 1H), 6.70~6.85 (m, 2H), 6.87~7.10 (m, 2H), 7.35 (m, 1H)

【0306】実施例52 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(1-ナフトキシアセチルアミノ)バレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号114)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1710, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.80~0.98 (m, 9H), 1.10~2.0 (m, 9H), 3.28 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.35 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.58 (m, 1H), 4.73 (s, 2H), 4.74 (m, 1H), 6.22 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.63 (d, $J=7$ Hz, 1H), 6.83 (d, J

=7 Hz, 1H), 7.01 (d, J=7.1 Hz, 1H), 7.32~7.60 (m, 5H), 7.83 (m, 1H), 8.21 (m, 1H)

【0307】実施例53 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2-ナフトキシアセチルアミノ)パレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号115)の製造

融点: 87~89℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3270, 1700, 1665, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.78~1.0 (m, 9H), 1.05~1.98 (m, 9H), 3.21~3.40 (m, 2H), 3.69 (s, 0.2H), 3.72 (s, 1.8H), 4.50~4.70 (m, 1H), 4.62 (s, 2H), 4.74 (m, 1H), 6.22 (d, J=3.1 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.67 (d, J=9 Hz, 0.9H), 6.80 (d, J=9 Hz, 0.1H), 6.97 (d, J=9 Hz, 1H), 7.12~7.93 (m, 8H)

【0308】実施例54 (s)-3-((s)-2-ベンゾイルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号116)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1710, 1630

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83 (t, J=6.7 Hz, 1.5H), 0.89 (t, J=6.7 Hz, 1.5H), 1.01 (d, J=5.8 Hz, 6H), 1.15~2.0 (m, 9H), 3.28 (d, J=15 Hz, 0.5H), 3.30 (d, J=15 Hz, 0.5H), 3.36 (d, J=15 Hz, 0.5H), 3.38 (d, J=15 Hz, 0.5H), 3.71 (s, 1H), 3.75 (s, 1H), 4.69~4.84 (m, 2H), 6.21 (d, J=2.5 Hz, 0.5H), 6.24 (d, J=2.5 Hz, 0.5H), 6.29 (m, 0.5H), 6.33 (m, 0.5H), 6.61 (d, J=7 Hz, 1H), 6.76 (d, J=7 Hz, 0.5H), 6.82 (d, J=7 Hz, 0.5H), 7.24~7.87 (m, 6H)

【0309】実施例55 (s)-3-[(s)-2-(2-フルオロベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号117)の製造

融点: 102~103℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3287, 1734, 1635

NMR (CDCl_3 , δ): 0.81 (t, J=6.7 Hz, 3H), 0.97 (d, J=5.6 Hz, 3

H), 0.99 (d, J=5.7 Hz, 3H), 1.15~1.40 (m, 4H), 1.51~1.65 (m, 1H), 1.65~1.82 (m, 3H), 1.90 (m, 1H), 3.27 (d, J=15 Hz, 1H), 3.35 (d, J=15 Hz, 1H), 3.72 (s, 2H), 4.63~4.82 (m, 2H), 6.23 (d, J=3.2 Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.74 (d, J=7.4 Hz, 1H), 7.04 (dd, J=9.0 Hz, 7.6 Hz, 1H), 7.12 (dd, J=12 Hz, 8.3 Hz, 1H), 7.27 (d, J=12 Hz, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.48 (m, 1H), 8.07 (dddd, J=7.8 Hz, 7.8 Hz, 1.7 Hz, 1H)

【0310】実施例56 (s)-3-[(s)-2-(3-フルオロベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号118)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3285, 1734, 1635

NMR (CDCl_3 , δ): 0.79 (t, J=6.7 Hz, 3H), 0.94 (d, J=5.0 Hz, 6H), 1.13~1.38 (m, 4H), 1.43~1.63 (m, 1H), 1.64~1.97 (m, 4H), 3.34 (s, 2H), 3.72 (s, 2H), 4.71 (m, 1H), 4.85 (m, 1H), 6.22 (d, J=3.1 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 7.16 (ddd, J=8.3 Hz, 8.3 Hz, 2.4 Hz, 1H), 7.28~7.45 (m, 3H), 7.50~7.62 (m, 3H)

【0311】実施例57 (s)-3-[(s)-2-(4-フルオロベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号119)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3315, 1716, 1637

NMR (CDCl_3 , δ): 0.81 (t, J=6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J=5.5 Hz, 6H), 1.17~1.39 (m, 4H), 1.57 (m, 1H), 1.62~1.82 (m, 3H), 1.89 (m, 1H), 3.27 (d, J=15 Hz, 1H), 3.35 (d, J=15 Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.65~4.87 (m, 2H), 6.22 (d, J=3.1 Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.67 (d, J=7.7 Hz, 1H), 6.75 (d, J=7.7 Hz, 1H), 7.11 (dd, J=8.7 Hz, 8.7 Hz, 2H), 7.36 (m, 1H), 7.75~7.84 (m, 2H)

【0312】実施例58 (s)-3-[(s)-2-(2,3-ジフルオロベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノ

ン(表-1の化合物番号120)の製造

融点: 120~122℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3285, 1734, 1658, 1635

NMR (CDCl_3 , δ): 0.82 (t, $J=6.6$ Hz, 3H), 0.98 (d, $J=6.0$ Hz, 3H), 0.99 (d, $J=6.2$ Hz, 3H), 1.15~1.39 (m, 4H), 1.56 (m, 1H), 1.63~1.82 (m, 3H), 1.90 (m, 1H), 3.27 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.30 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.72 (s, 2H), 4.68 (m, 1H), 4.76 (m, 1H), 6.23 (d, $J=3.1$ Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.64 (d, $J=7.4$ Hz, 1H), 6.92 (d, $J=11$ Hz, 0.5H), 6.96 (d, $J=11$ Hz, 0.5H), 7.17~7.40 (m, 4H)

【0313】実施例59 (s)-3-[(s)-2-(2,4-ジフルオロベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号121)の製造

融点: 97~98℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3283, 1730, 1658, 1633

NMR (CDCl_3 , δ): 0.82 (t, $J=6.7$ Hz, 3H), 0.97 (d, $J=6.1$ Hz, 3H), 0.99 (d, $J=6.1$ Hz, 3H), 1.17~1.39 (m, 4H), 1.57 (m, 1H), 1.61~1.82 (m, 3H), 1.89 (m, 1H), 3.27 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.35 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.69 (m, 1H), 4.77 (m, 1H), 6.22 (d, $J=3.2$ Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.67 (d, $J=7.3$ Hz, 1H), 6.82~7.05 (m, 3H), 7.36 (m, 1H), 8.11 (m, 1H)

【0314】実施例60 (s)-3-[(s)-2-(2,5-ジフルオロベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号122)の製造

融点: 102℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3283, 1734, 1637

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83 (t, $J=6.8$ Hz, 3H), 0.98 (d, $J=6.0$ Hz, 3H), 0.99 (d, $J=5.9$ Hz, 3H), 1.17~1.37 (m, 4H), 1.49~1.82 (m, 4H), 1.90 (m, 1H), 3.27 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.35 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.69 (m, 1H),

4.77 (m, 1H), 6.22 (d, $J=3.2$ Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.64 (d, $J=6.5$ Hz, 1H), 7.02~7.23 (m, 3H), 7.35 (m, 1H), 7.75 (m, 1H)

【0315】実施例61 (s)-3-[(s)-2-(2,6-ジフルオロベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号123)の製造

融点: 116℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3250, 1720, 1670, 1640, 1620

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, $J=6.7$ Hz, 3H), 0.99 (d, $J=5.8$ Hz, 6H), 1.18~1.41 (m, 4H), 1.50~1.82 (m, 4H), 1.89 (m, 1H), 3.27 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.35 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.65~4.86 (m, 2H), 6.22 (d, $J=3.2$ Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.44 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 6.73 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 6.95 (dd, $J=8.1$ Hz, 8.1 Hz, 2H), 7.31~7.43 (m, 2H)

【0316】実施例62 (s)-3-[(s)-2-(3,4-ジフルオロベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号124)の製造

融点: 94~100℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3315, 1720, 1639, 1602

NMR (CDCl_3 , δ): 0.79 (t, $J=7.0$ Hz, 3H), 0.86 (d, $J=5.1$ Hz, 6H), 1.09~1.39 (m, 4H), 1.47~1.64 (m, 1H), 1.64~1.98 (m, 4H), 3.34 (s, 2H), 3.73 (s, 2H), 4.72 (m, 1H), 4.85 (m, 1H), 6.22 (d, $J=3.2$ Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 7.12 (ddd, $J=8.6$ Hz, 8.6 Hz, 8.6 Hz, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.45~7.63 (m, 2H), 7.67 (m, 1H), 7.89 (m, 1H)

【0317】実施例63 (s)-3-[(s)-2-(3,5-ジフルオロベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号125)の製造

融点: 125~126℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3283, 1723, 1637

NMR (CDCl_3 , δ): 0.84 (t, $J=6.7$ Hz, 3H), 0.97 (d, $J=6.1$ Hz, 6H), 1.17~1.40 (m, 4H), 1.54

(m, 1H), 1.64~1.82 (m, 3H), 1.90 (m, 1H), 3.28 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.68 (m, 1H), 4.81 (m, 1H), 6.22 (d, J=3.0Hz, 1H), 6.31 (m, 1H), 6.66 (d, J=7.6Hz, 1H), 6.85 (d, J=8.2Hz, 1H), 6.95 (m, 1H), 7.25~7.31 (m, 2H), 7.37 (m, 1H)

【0318】実施例64 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2, 3, 4-トリフルオロベンゾイルアミノ) パレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号126) の製造

融点: 101~102℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3288, 1732, 1660, 1637

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83 (t, J=6.8Hz, 3H), 0.98 (d, J=6.1Hz, 3H), 0.99 (d, J=6.1Hz, 3H), 1.17~1.40 (m, 4H), 1.47~1.82 (m, 4H), 1.91 (m, 1H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.70 (m, 1H), 4.80 (m, 1H), 6.22 (d, J=3.1Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.61 (d, J=6.0Hz, 1H), 6.91 (d, J=9.0Hz, 0.5H), 6.95 (d, J=9.0Hz, 0.5H), 7.11 (m, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.83 (m, 1H)

【0319】実施例65 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2, 3, 6-トリフルオロベンゾイルアミノ) パレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号128) の製造

融点: 116~117℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3281, 1734, 1647

NMR (CDCl_3 , δ): 0.88 (t, J=6.8Hz, 3H), 0.99 (d, J=4.9Hz, 6H), 1.18~1.42 (m, 4H), 1.50~1.82 (m, 4H), 1.92 (m, 1H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.71 (m, 1H), 4.81 (m, 1H), 6.22 (d, J=3.2Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.48 (d, J=7.9Hz, 1H), 6.64 (d, J=7.3Hz, 1H), 6.92 (m, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.36 (m, 1H)

【0320】実施例66 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(3, 4, 5-トリフルオロベンゾイルアミノ) パレリルアミノ]-2-ヘ

プタノン (表-1の化合物番号130) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3298, 1716, 1639

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83 (t, J=6.7Hz, 3H), 0.98 (d, J=6.7Hz, 6H), 1.13~1.39 (m, 4H), 1.47~1.80 (m, 4H), 1.91 (m, 1H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.70 (m, 1H), 4.78 (m, 1H), 6.22 (d, J=2.9Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.92 (d, J=7.6Hz, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.41~7.59 (m, 3H)

【0321】実施例67 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2, 3, 4, 5-テトラフルオロベンゾイルアミノ) パレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号132) の製造

融点: 107~108℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3277, 1705, 1641

NMR (CDCl_3 , δ): 0.84 (t, J=7.0Hz, 3H), 0.98 (d, J=5.9Hz, 6H), 1.15~1.38 (m, 4H), 1.43~1.80 (m, 4H), 1.90 (m, 1H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.67 (m, 1H), 4.81 (m, 1H), 6.22 (d, J=3.3Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.57 (d, J=7.6Hz, 1H), 6.99 (d, J=8.0Hz, 0.5H), 7.03 (d, J=8.0Hz, 0.5H), 7.36 (m, 1H), 7.70 (m, 1H)

【0322】実施例68 (s)-1-フルフリルチオ-3-((s)-4-メチル-2-ペンタフルオロベンゾイルアミノ) パレリルアミノ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号135) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3287, 1714, 1653

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, J=6.7Hz, 3H), 0.98 (d, J=5.4Hz, 6H), 1.12~1.39 (m, 4H), 1.45~1.79 (m, 4H), 1.80~1.98 (m, 1H), 3.31 (s, 2H), 3.72 (s, 2H), 4.63~4.84 (m, 2H), 6.21 (d, J=3.2Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.68 (d, J=7.8Hz, 1H), 6.88 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.35 (m, 1H)

【0323】実施例69 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2-トルオイルアミノ) パレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化

化合物番号140)の製造

融点: 118~119℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3275, 1734, 1635

NMR (CDCl_3 , δ): 0.86 (t, $J=6.9$ Hz, 3H), 0.99 (d, $J=5.7$ Hz, 6H), 1.17~1.40 (m, 4H), 1.44~1.80 (m, 4H), 1.91 (m, 1H), 2.44 (s, 3H), 3.72 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.35 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.74 (s, 2H), 4.65 (m, 1H), 4.80 (m, 1H), 6.15 (d, $J=8.2$ Hz, 1H), 6.22 (d, $J=3.3$ Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.73 (d, $J=8.3$ Hz, 1H), 7.17~7.41 (m, 5H)

【0324】実施例70 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(3-トルオイルアミノ)バレルリアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号141)の製造

融点: 123~126℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3285, 1732, 1635

NMR (CDCl_3 , δ): 0.82 (t, $J=6.8$ Hz, 3H), 0.98 (d, $J=5.9$ Hz, 6H), 1.15~1.38 (m, 4H), 1.56 (m, 1H), 1.62~1.99 (m, 4H), 2.39 (s, 3H), 3.27 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.35 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.65~4.81 (m, 2H), 6.22 (d, $J=3.0$ Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.56 (d, $J=8.3$ Hz, 1H), 6.77 (d, $J=7.7$ Hz, 1H), 7.28~7.34 (m, 2H), 7.36 (m, 1H), 7.55~7.62 (m, 2H)

【0325】実施例71 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(4-トルオイルアミノ)バレルリアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号142)の製造

融点: 122~123℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3292, 1732, 1657

NMR (CDCl_3 , δ): 0.81 (t, $J=6.7$ Hz, 3H), 0.97 (d, $J=5.6$ Hz, 6H), 1.17~1.37 (m, 4H), 1.43~1.98 (m, 5H), 2.39 (s, 3H), 3.27 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.35 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.65~4.81 (m, 2H), 6.22 (d, $J=3.2$ Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.52 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 6.75 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.24 (d, $J=8.1$ Hz, 2H), 7.36 (m, 1H), 7.67 (d, $J=8.1$ Hz, 2H)

z, 1H), 7.24 (d, $J=8.1$ Hz, 2H), 7.36 (m, 1H), 7.67 (d, $J=8.1$ Hz, 2H)

【0326】実施例72 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2-トリフルオロメチルベンゾイルアミノ)バレルリアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号143)の製造

融点: 102~106℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3283, 1734, 1641, 1604

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, $J=6.9$ Hz, 3H), 0.98 (d, $J=5.8$ Hz, 6H), 1.18~1.39 (m, 4H), 1.43~2.0 (m, 5H), 3.27 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.35 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.72 (s, 2H), 4.62~4.81 (m, 2H), 6.21 (d, $J=3.2$ Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.51 (d, $J=8.4$ Hz, 1H), 6.89 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.43~7.62 (m, 3H), 7.69 (dd, $J=9.0$ Hz, 2.4 Hz, 1H)

【0327】実施例73 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルベンゾイルアミノ)バレルリアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号145)の製造

融点: 121~123℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3289, 1732, 1657, 1639

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83 (t, $J=6.8$ Hz, 3H), 0.97 (d, $J=6.0$ Hz, 6H), 1.17~1.39 (m, 4H), 1.43~1.82 (m, 4H), 1.87 (m, 1H), 3.28 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.35 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.74 (s, 2H), 4.63~4.84 (m, 2H), 6.22 (d, $J=3.1$ Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.61 (d, $J=7.3$ Hz, 1H), 6.75 (d, $J=7.9$ Hz, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.69 (d, $J=8.4$ Hz, 2H), 7.89 (d, $J=8.4$ Hz, 2H)

【0328】実施例74 (s)-3-[(s)-2-(2-フルオロ-6-トリフルオロメチルベンゾイルアミノ)-4-メチルバレルリアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号146)の製造

融点: 106~107℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3266, 1720, 1641

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83 (t, $J=6.7$ Hz, 3H), 0.99 (d, $J=5.0$ Hz, 6

H), 1.15~1.39 (m, 4H), 1.47~2.02 (m, 5H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.60~4.80 (m, 2H), 6.22 (d, J=3.1Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.60 (d, J=7.7Hz, 1H), 7.13 (dd, J=8.0Hz, 7.7Hz, 1H), 7.20~7.36 (m, 1H), 7.37 (m, 1H), 7.75 (m, 1H), 8.38 (d, J=6.7Hz, 1.9Hz, 1H)

【0329】実施例75 (s)-3-[(s)-2-(2-フルオロ-4-トリフルオロメチルベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号148) の製造

融点: 102~106℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3289, 1732, 1643

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83 (t, J=6.8Hz, 3H), 0.97 (d, J=6.0Hz, 6H), 1.17~1.39 (m, 4H), 1.45~2.0 (m, 5H), 3.28 (d, J=15Hz, 1H), 3.36 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.63~4.84 (m, 2H), 6.22 (m, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.71 (d, J=7.7Hz, 1H), 7.13 (dd, J=11Hz, 8.0Hz, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.42 (d, J=11Hz, 1H), 7.53 (dd, J=8.0Hz, 0.8Hz, 1H), 8.18 (dd, J=7.9Hz, 7.6Hz, 1H)

【0330】実施例76 (s)-3-[(s)-2-(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号149) の製造

融点: 112~114℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3297, 1715, 1642

NMR (CDCl_3 , δ): 0.82 (t, J=6.7Hz, 3H), 0.98 (d, J=5.2Hz, 6H), 1.15~1.40 (m, 4H), 1.45~1.81 (m, 4H), 1.87 (m, 1H), 3.28 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.74 (s, 2H), 4.62~4.83 (m, 2H), 6.22 (d, J=3.3Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.64 (d, J=7.1Hz, 1H), 6.93 (d, J=6.5Hz, 1H), 7.27 (m, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.99 (m, 1H), 8.05 (dd, J=6.7Hz, 4.8Hz, 1H)

【0331】実施例77 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-2-(2-メトキシベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号151) の製造

融点: 77~78℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3306, 2953, 1732, 1660, 1630, 1601

NMR (CDCl_3 , δ): 0.77 (t, J=6.8Hz, 3H), 0.96 (d, J=6.1Hz, 3H), 0.98 (d, J=6.1Hz, 3H), 1.17~1.37 (m, 4H), 1.45~1.99 (m, 5H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.72 (s, 2H), 3.97 (s, 3H), 4.65~4.78 (m, 2H), 6.22 (d, J=3.2Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.95~7.04 (m, 2H), 7.09 (d, J=7.3Hz, 0.5H), 7.13 (d, J=7.3Hz, 0.5H), 7.35 (m, 1H), 7.46 (d, J=7.3Hz, 0.5H), 7.50 (d, J=7.3Hz, 0.5H), 8.17 (dd, J=7.8Hz, 1.9Hz, 2H)

【0332】実施例78 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-2-(3-メトキシフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号103) の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3288, 1730, 1651, 1602

NMR (CDCl_3 , δ): 0.86 (t, J=6.8Hz, 3H), 0.93 (d, J=5.9Hz, 6H), 1.17~1.40 (m, 4H), 1.47~1.80 (m, 4H), 1.83 (m, 1H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 3.79 (s, 3H), 4.47 (d, J=10Hz, 1H), 4.52 (d, J=10Hz, 1H), 4.63 (m, 1H), 4.78 (m, 1H), 6.22 (d, J=3.2Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.50~6.65 (m, 3H), 7.01 (t, J=8.7Hz, 2H), 7.20 (t, J=8.7Hz, 1H), 7.35 (m, 1H)

【0333】実施例79 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-2-(4-メトキシベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号153) の製造

融点: 124℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3291, 1732, 1655, 1624

NMR (CDCl_3 , δ): 0.81 (t, J=6.1Hz, 3H), 0.98 (d, J=5.0Hz, 6

H), 1.15~1.35 (m, 4H), 1.45~1.95 (m, 5H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.36 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 4.63~4.80 (m, 2H), 6.23 (m, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.46 (d, J=8.7Hz, 1H), 6.75 (d, J=7.5Hz, 1H), 6.92 (d, J=8.8Hz, 2H), 7.36 (m, 1H), 7.75 (d, J=8.8Hz, 2H)

【0334】実施例80 (s)-3-[(s)-2-(3,5-ジメトキシベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号155)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3279, 1713, 1636

NMR (CDCl_3 , δ): 0.82 (t, J=6.8Hz, 3H), 0.97 (d, J=5.7Hz, 6H), 1.17~1.39 (m, 4H), 1.45~1.81 (m, 4H), 1.89 (m, 1H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 3.82

(s, 6H), 4.62~4.82 (m, 2H), 6.22 (d, J=3.2Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.55 (d, J=6.8Hz, 1H), 6.57 (m, 1H), 6.73 (d, J=6.9Hz, 1H), 6.89 (m, 2H), 7.35 (m, 1H)

【0335】実施例81 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-2-(4-メトキシカルボニルベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号157)の製造

融点: 100~102°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3279, 1726, 1662, 1637

NMR (CDCl_3 , δ): 0.82 (t, J=6.7Hz, 3H), 0.98 (d, J=5.8Hz, 6H), 1.18~1.40 (m, 4H), 1.50~1.64 (m, 1H), 1.64~2.0 (m, 4H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.36 (d, J=15Hz, 1H), 3.74 (s, 2H), 3.95 (s, 3H), 4.67~4.83 (m, 2H), 6.22 (d, J=3.2Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.75 (d, J=7.7Hz, 1H), 6.81 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.84 (d, J=8.3Hz, 2H), 8.09 (d, J=8.3Hz, 2H)

【0336】実施例82 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2-ナフトイルアミノ)バレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号162)の製造

融点: 97~99°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3270, 1700, 1650, 1620

NMR (CDCl_3 , δ): 0.77 (t, J=6.8Hz, 3H), 1.0 (d, J=4.8Hz, 6H), 1.15~2.0 (m, 9H), 3.23~3.40 (m, 2H), 3.66 (s, 0.7H), 3.73 (s, 1.3H), 4.70~4.96 (m, 2H), 6.21 (d, J=3.0Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.87~7.17 (m, 2H), 7.21~7.40 (m, 1H), 7.47~7.63 (m, 2H), 7.76~8.0 (m, 4H), 8.29 (s, 1H)

【0337】実施例83 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(1-ナフトイルアミノ)バレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号161)の製造

融点: 81~83°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3270, 1720, 1650, 1630

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87~0.95 (m, 3H), 1.01 (d, J=6.3Hz, 3H), 1.04 (d, J=6.3Hz, 3H), 1.17~2.0 (m, 9H), 3.25~3.39 (m, 2H), 3.71 (s, 0.7H), 3.74 (s, 1.3H), 4.75~4.93 (m, 2H), 6.19 (d, J=3.3Hz, 0.4H), 6.23 (d, J=3.3Hz, 0.6H), 6.27~6.31 (m, 1H), 6.44 (d, J=8Hz, 1H), 6.85 (d, J=7Hz, 0.6H), 6.98 (d, J=7Hz, 0.4H), 7.30~7.40 (m, 1H), 7.41~7.70 (m, 4H), 7.92~8.0 (m, 2H), 8.27~8.39 (m, 1H)

【0338】実施例84 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-2-(4-メトキシシンナモイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号165)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3269, 1715, 1647, 1603

NMR (CDCl_3 , δ): 0.81 (t, J=6.7Hz, 3H), 0.95 (d, J=4.6Hz, 6H), 1.17~1.38 (m, 4H), 1.46~1.79 (m, 4H), 1.87 (m, 1H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 4.67~4.84 (m, 2H), 6.21 (d, J=3.1Hz, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.36 (d, J=16Hz, 1H), 6.69 (d, J=8.4Hz, 1H), 6.83 (d, J=8.7Hz, 2H), 7.26 (d, J=6.9Hz, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.41 (d, J=

8. 7 Hz, 2H), 7. 57 (d, J=16 Hz, 1 H)

【0339】実施例85 (s)-3-[(s)-2-(2, 4-ジメトキシシンナモイルアミノ)-3-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号166)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3270, 1718, 1645, 1604

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 86 (t, J=8. 6 Hz, 3H), 0. 96 (d, J=5. 6 Hz, 6 H), 1. 17~1. 38 (m, 4H), 1. 45~1. 79 (m, 4H), 1. 84 (m, 1H), 3. 27 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 35 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 73 (s, 2H), 3. 83 (s, 3H), 3. 84 (s, 3H), 4. 63~4. 82 (m, 2H), 6. 18 (d, J=6. 8 Hz, 1 H), 6. 22 (d, J=3. 0 Hz, 1H), 6. 29 (m, 1H), 6. 40~6. 58 (m, 3H), 7. 01 (d, J=6. 4 Hz, 1H), 7. 31~7. 42 (m, 2H), 7. 79 (d, J=16 Hz, 1H)

【0340】実施例86 (s)-3-[(s)-2-(1-アセチル-4-ピペリジルカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号168)の製造

融点: 110~112°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1715, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 81~1. 01 (m, 9H), 1. 19~1. 39 (m, 4H), 1. 47~1. 78 (m, 6H), 1. 78~1. 97 (m, 3 H), 2. 09 (s, 3H), 2. 42 (m, 1H), 2. 67 (m, 1H), 3. 09 (m, 1H), 3. 29 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 34 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 72 (s, 2H), 3. 86 (d, J=13 Hz, 1H), 4. 45~4. 62 (m, 2H), 4. 68 (m, 1H), 6. 22 (d, J=3. 0 Hz, 1H), 6. 29 (m, 1H), 6. 71 (d, J=6. 2 Hz, 1H), 7. 20 (d, J=7. 4 Hz, 1H), 7. 35 (m, 1H)

【0341】実施例87 (s)-3-[(s)-2-(1-tert-ブトキシカルボニル-4-ピペリジルカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号171)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3289, 1698, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 78~1. 02 (m, 9H), 1. 13~1. 71 (m, 10H), 1. 45 (s, 9H), 1. 71~1. 97 (m, 3H), 2.

30 (m, 1H), 2. 61~2. 83 (m, 2H), 3. 28 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 33 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 72 (s, 2H), 4. 0~4. 22 (m, 2H), 4. 52 (m, 1H), 4. 69 (m, 1H), 6. 22 (m, 1H), 6. 29 (m, 1H), 6. 43 (d, J=8. 3 Hz, 1 H), 7. 05 (d, J=7. 6 Hz, 1H), 7. 35 (m, 1H)

【0342】実施例88 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(4-ピペリジルカルボニルアミノ)パレリルアミノ]-2-ヘプタノン塩酸塩(表-1の化合物番号172)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 3250, 1700, 1660, 1635

NMR (CD_3OD , δ): 0. 81~1. 05 (m, 9H), 1. 21~1. 43 (m, 4H), 1. 50~1. 78 (m, 5H), 1. 78~2. 17 (m, 4 H), 2. 64 (m, 1H), 2. 95~3. 17 (m, 2H), 3. 24~3. 57 (m, 4H), 3. 72 (s, 2H), 4. 39 (dd, J=7. 0 Hz, 7. 0 Hz, 1H), 4. 55 (dd, J=9. 4 Hz, 4. 3 Hz, 1H), 6. 22 (d, J=2. 7 Hz, 1H), 6. 32 (m, 1H), 7. 41 (m, 1 H)

【0343】実施例89 (s)-1-フルフリルチオ-3-((s)-4-メチル-2-ニコチノイルアミノパレリルアミノ)-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号176)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3280, 1715, 1660, 1630

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 80 (t, J=7. 0 Hz, 3H), 0. 94 (d, J=6. 7 Hz, 6 H), 1. 12~1. 39 (m, 4H), 1. 51 (m, 1H), 1. 67~1. 80 (m, 3H), 1. 84 (m, 1H), 3. 29 (d, J=15 Hz, 1 H), 3. 35 (d, J=15 Hz, 1H), 3. 73 (s, 2H), 4. 70~4. 84 (m, 2H), 6. 22 (d, J=3. 2 Hz, 1H), 6. 30 (m, 1 H), 6. 98 (d, J=7. 7 Hz, 1H), 7. 17 (d, J=8. 0 Hz, 1H), 7. 30~7. 42 (m, 2H), 8. 11 (dd, J=8. 0 Hz, 1. 9 Hz, 1H), 8. 73 (dd, J=4. 8 Hz, 1. 6 Hz, 1H), 9. 04 (d, J=1. 9 Hz, 1H)

【0344】実施例90 (s)-3-((s)-2-イソニコチノイルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号177)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3280, 1715, 1630

NMR (CDCl₃, δ) : 0.81 (t, J=6.7 Hz, 3H), 0.92 (d, J=4.0 Hz, 6H), 1.15~1.39 (m, 5H), 1.59 (m, 1H), 1.64~1.98 (m, 3H), 3.33 (s, 2H), 3.73 (s, 2H), 4.68~4.95 (m, 2H), 6.22 (d, J=3.2 Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 7.35 (d, J=1.9 Hz, 1H), 7.43 (d, J=6.7 Hz, 1H), 7.58~7.71 (m, 2H), 7.81 (d, J=7.5 Hz, 1H), 8.65~8.69 (m, 2H)

【0345】実施例91 (s)-3-[(s)-2-(2-ベンゾフラニルカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号180) の製造

IR (neat, cm⁻¹) : 3300, 1710, 1640

NMR (CDCl₃, δ) : 0.81 (t, J=6.9 Hz, 2.2H), 0.89 (t, J=6.9 Hz, 0.8H), 1.0 (d, J=6.5 Hz, 6H), 1.10~1.99 (m, 9H), 3.23~3.40 (m, 2H), 3.70 (d, J=5.4 Hz, 0.5H), 3.73 (s, 1.5H), 4.76~4.93 (m, 2H), 6.18 (m, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.70 (d, J=7 Hz, 0.75H), 6.76 (d, J=7 Hz, 0.25H), 7.05 (d, J=8 Hz, 1H), 7.25~7.59 (m, 5H), 7.67 (d, J=7.4 Hz, 1H)

【0346】実施例92 (s)-3-[(s)-2-(3-ベンゾフラニルカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号181) の製造

融点: 113~116℃

IR (KBr, cm⁻¹) : 3300, 1710, 1630

NMR (CDCl₃, δ) : 0.77 (t, J=6.7 Hz, 3H), 0.83~1.02 (m, 6H), 1.07~1.38 (m, 5H), 1.41~1.63 (m, 1H), 1.63~1.97 (m, 3H), 3.30 (d, J=15 Hz, 1H), 3.35 (d, J=15 Hz, 1H), 3.72 (s, 2H), 4.70 (m, 1H), 4.80 (dt, J=7.1 Hz, 7.0 Hz, 1H), 6.21 (d, J=3.1 Hz, 1H), 6.28 (m, 1H), 7.21~7.38 (m, 4H), 7.38~7.57 (m, 2H), 7.93 (m, 1H), 8.23 (d, J=1.4 Hz, 1H)

【0347】実施例93 (s)-3-[(s)-2-(7-フルオロ-2-ベンゾフラニルカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチ

オ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号182) の製造

融点: 102~103℃

IR (KBr, cm⁻¹) : 3270, 1700, 1650

NMR (CDCl₃, δ) : 0.79 (t, J=6.8 Hz, 3H), 0.98 (d, J=4.9 Hz, 6H), 1.18~1.40 (m, 4H), 1.60 (m, 1H), 1.64~1.97 (m, 4H), 3.32 (d, J=15 Hz, 1H), 3.40 (d, J=15 Hz, 1H), 3.75 (s, 2H), 4.75~4.95 (m, 2H), 6.23 (d, J=3.1 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 7.08~7.35 (m, 5H), 7.37 (s, 1H), 7.42 (dd, J=7.5 Hz, 1.1 Hz, 1H)

【0348】実施例94 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(4-オキソ-4H-1-ベンゾピラン-4-イルカルボニルアミノ)パレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号188) の製造

融点: 114~115℃

IR (KBr, cm⁻¹) : 3350, 3250, 1705, 1660, 1625

NMR (CDCl₃, δ) : 0.84 (t, J=6.8 Hz, 3H), 1.0 (d, J=9.2 Hz, 6H), 1.15~2.0 (m, 9H), 3.30 (d, J=15 Hz, 1H), 3.38 (d, J=15 Hz, 1H), 3.75 (s, 2H), 4.69 (m, 1H), 4.82 (m, 1H), 6.23 (d, J=2.9 Hz, 1H), 6.31 (m, 1H), 6.61 (d, J=8 Hz, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.36~7.55 (m, 3H), 7.57 (d, J=14 Hz, 1H), 7.72~7.80 (m, 1H), 8.22 (dd, J=1.6 Hz, 7.9 Hz, 1H)

【0349】実施例95 (s)-3-(2s, 3s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-3-メチルパレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号205) の製造

融点: 101~103℃

IR (KBr, cm⁻¹) : 3300, 3250, 1705, 1680, 1640

NMR (CDCl₃, δ) : 0.83~1.10 (m, 9H), 1.07~1.39 (m, 3H), 1.42~1.78 (m, 4H), 1.82~2.01 (m, 2H), 3.26 (d, J=15 Hz, 1H), 3.34 (d, J=15 Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.05 (dt, J=8.0 Hz, 6.4 Hz, 1H), 4.80 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 5.30 (d, J=7.7 Hz, 1H), 6.22 (d, J=3.3 Hz, 1H), 6.30 (m, 1

H), 6.43 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.30~7.41 (m, 6H)

【0350】実施例96 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノヘキサノイルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号206)の製造

融点: 95~97℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3280, 1730, 1690, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.82~0.99 (m, 6H), 1.12~1.45 (m, 8H), 1.49~1.65 (m, 2H), 1.75~1.99 (m, 2H), 3.27 (d, J=15 Hz, 1H), 3.34 (d, J=15 Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.16 (td, J=7.3 Hz, 6.4 Hz, 1H), 4.76 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 5.26 (d, J=7.9 Hz, 1H), 6.21 (d, J=3.1 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.56 (d, J=6.4 Hz, 1H), 7.29~7.39 (m, 6H)

【0351】実施例97 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-3-フェニルプロピオニルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号208)の製造

融点: 123~124℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1720, 1710, 1680, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85 (t, J=6.9 Hz, 3H), 1.0~1.38 (m, 2H), 1.51 (m, 1H), 1.61~1.69 (m, 2H), 1.83 (m, 1H), 3.03 (dd, J=14 Hz, 7.0 Hz, 1H), 3.15 (dd, J=14 Hz, 7.0 Hz, 1H), 3.15 (d, J=15 Hz, 1H), 3.22 (d, J=15 Hz, 1H), 3.67 (s, 2H), 4.45 (td, J=6.9 Hz, 6.9 Hz, 1H), 4.70 (m, 1H), 5.09 (s, 2H), 5.27 (d, J=5.6 Hz, 1H), 6.21 (d, J=3.0 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.40 (d, J=6.9 Hz, 1H), 7.09~7.21 (m, 2H), 7.21~7.42 (m, 9H)

【0352】実施例98 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-3-tert-ブトキシプロピオニルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号210)の製造

融点: 71~73℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1720, 1690, 1660, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.88 (t, J=6.8 Hz, 3H), 1.16 (s, 9H), 1.24~1.

41 (m, 4H), 1.59 (m, 1H), 1.91 (m, 1H), 3.24 (d, J=15 Hz, 1H), 3.30 (d, J=15 Hz, 1H), 3.42 (d, J=7.2 Hz, 7.2 Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 3.84 (m, 1H), 4.26 (m, 1H), 4.77 (m, 1H), 5.10 (d, J=12 Hz, 1H), 5.16 (d, J=12 Hz, 1H), 5.71 (d, J=5.1 Hz, 1H), 6.21 (d, J=3.2 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 7.23 (d, J=5.1 Hz, 1H), 7.35~7.41 (m, 6H)

【0353】実施例99 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-3-tert-ブトキシカルボニルプロピオニルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号213)の製造

融点: 77~78℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1720, 1690, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.88 (t, J=6.8 Hz, 3H), 1.18~1.38 (m, 4H), 1.43 (s, 9H), 1.58 (m, 1H), 1.84 (m, 1H), 2.62 (dd, J=17 Hz, 6.5 Hz, 1H), 2.96 (dd, J=17 Hz, 4.1 Hz, 1H), 3.24 (d, J=15 Hz, 1H), 3.32 (d, J=15 Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.54 (m, 1H), 4.72 (m, 1H), 5.15 (s, 2H), 5.98 (d, J=8.5 Hz, 1H), 6.22 (d, J=2.3 Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 7.10 (d, J=7.0 Hz, 1H), 7.30~7.43 (m, 6H)

【0354】実施例100 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-tert-ブトキシカルボニルブチルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号216)の製造

融点: 78~79℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1730, 1710, 1690, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.88 (t, J=6.8 Hz, 3H), 1.18~1.39 (m, 4H), 1.44 (s, 9H), 1.50~1.70 (m, 1H), 1.81~2.17 (m, 3H), 2.31~2.49 (m, 2H), 3.26 (d, J=15 Hz, 1H), 3.29 (d, J=15 Hz, 1H), 3.72 (s, 2H), 4.25 (dt, J=7.4 Hz, 6.8 Hz, 1H), 4.75 (m, 1H), 5.11 (s, 2H), 5.73 (d, J=6.8 Hz, 1H), 6.22 (d, J=3.0 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.82 (d, J=7.4 Hz, 1H), 7.27~7.39 (m, 6H)

【0355】実施例101 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-カルボキシブチルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン

(表-1の化合物番号217)の製造

融点: 67~71℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1720, 1705, 1680, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.81~0.98 (m, 3H), 1.18~1.43 (m, 4H), 1.60 (m, 1H), 1.72~2.0 (m, 2H), 2.10 (m, 1H), 2.37 (t, $J=7.5\text{Hz}$, 2H), 3.23~3.37 (m, 2H), 3.72 (s, 2H), 4.15 (dt, $J=5.0\text{Hz}$, 3.9Hz, 1H), 4.57 (m, 1H), 5.08 (s, 2H), 6.22 (d, $J=2.9\text{Hz}$, 1H), 6.31 (m, 1H), 7.21~7.39 (m, 5H), 7.40 (m, 1H)

【0356】実施例102 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-6-tert-ブトキシカルボニルアミノヘキサノイルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号220)の製造

融点: 60~63℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 1725, 1690, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, $J=6.7\text{Hz}$, 3H), 1.15~1.78 (m, 10H), 1.41 (s, 9H), 1.79~1.99 (m, 2H), 2.97~3.18 (m, 2H), 3.25 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.35 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.18 (m, 1H), 4.59~4.82 (m, 2H), 5.10 (s, 2H), 5.63 (m, 1H), 6.22 (d, $J=2.9\text{Hz}$, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.78 (d, $J=7.8\text{Hz}$, 1H), 7.24~7.41 (m, 6H)

【0357】実施例103 (s)-3-((s)-6-アミノ-2-ベンジロキシカルボニルアミノヘプタノイルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン塩酸塩 (表-1の化合物番号221)の製造

融点: 95℃ (分解)

IR (KBr, cm^{-1}): 3310, 1720, 1680, 1635

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85~1.05 (m, 3H), 1.22~1.42 (m, 4H), 1.42~2.0 (m, 8H), 2.96 (t, $J=7.5\text{Hz}$, 2H), 3.44 (s, 2H), 3.76 (s, 2H), 4.18 (dd, $J=8.5\text{Hz}$, 5.8Hz, 1H), 4.64 (m, 1H), 5.14 (s, 2H), 6.27 (d, $J=3.1\text{Hz}$, 1H), 6.3

7 (m, 1H), 7.26~7.43 (m, 5H), 7.46 (m, 1H), 8.33 (d, $J=7.9\text{Hz}$, 1H)

【0358】実施例104 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-2-フェニルアセチルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号224)の製造

融点: 144~146℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1710, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, $J=7.1\text{Hz}$, 3H), 1.07~1.39 (m, 4H), 1.42~1.63 (m, 1H), 1.81~1.99 (m, 1H), 3.13 (s, 2H), 3.54 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.59 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 4.71 (m, 1H), 5.03 (d, $J=12\text{Hz}$, 1H), 5.11 (d, $J=12\text{Hz}$, 1H), 5.23 (d, $J=6.1\text{Hz}$, 1H), 6.07 (d, $J=6.3\text{Hz}$, 1H), 6.10 (d, $J=3.1\text{Hz}$, 1H), 6.21 (m, 1H), 6.31 (d, $J=7.4\text{Hz}$, 1H), 7.24~7.43 (m, 11H)

【0359】実施例105 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-(2-ピリジルメチルチオ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号226)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3304, 1711, 1658

NMR (CD_3OD , δ): 0.80~1.0 (m, 9H), 1.16~1.40 (m, 4H), 1.45~1.98 (m, 5H), 3.25~3.40 (m, 2H), 3.80 (s, 2H), 4.15 (m, 1H), 4.57 (m, 1H), 5.07 (s, 2H), 7.25~7.39 (m, 6H), 7.42 (d, $J=7.8\text{Hz}$, 1H), 7.76 (ddd, $J=7.7\text{Hz}$, 7.7Hz, 1.8Hz, 1H), 8.44 (m, 1H)

【0360】実施例106 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-(3-ピリジルメチルチオ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号228)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3409, 1717, 1653

NMR (CD_3OD , δ): 0.92~1.03 (m, 9H), 1.18~1.43 (m, 4H), 1.47~1.98 (m, 5H), 3.36 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.42 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.94 (s, 2H), 4.15 (dd, $J=7.6\text{Hz}$, 7.5Hz, 1H), 4.48 (dd, $J=9.6\text{Hz}$, 4.4Hz, 1H), 5.06 (d, $J=10\text{H}$

z, 1H), 5.11 (d, J=10Hz, 1H), 7.21~7.40 (m, 5H), 8.04 (dd, J=8.0Hz, 5.8Hz, 1H), 8.62 (d, J=8.0Hz, 1H), 8.75 (d, J=5.8Hz, 1H), 8.83 (s, 1H)

【0361】実施例107 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(4-ピリジルメチルチオ)-2-ヘブタンोन (表-1の化合物番号230)の製造

IR (neat, cm⁻¹): 3300, 1720, 1705, 1660, 1600

NMR (CDCl₃, δ): 0.86 (t, J=6.7Hz, 3H), 0.91~0.95 (m, 6H), 1.13~1.39 (m, 5H), 1.41~1.78 (m, 3H), 1.84 (m, 1H), 3.11 (d, J=15Hz, 1H), 3.24 (d, J=15Hz, 1H), 3.63 (s, 2H), 4.22 (m, 1H), 4.75 (m, 1H), 5.11 (s, 2H), 5.38 (d, J=8.0Hz, 1H), 6.81 (d, J=6.9Hz, 1H), 7.15~7.31 (m, 2H), 7.31~7.41 (m, 5H), 8.45~8.60 (m, 2H)

【0362】実施例108 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-4-シクロヘキシル-1-メチルチオ-2-ブタンोन (表-1の化合物番号236)の製造

融点: 83~84℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3320, 1684, 1648

NMR (CDCl₃, δ): 0.90~1.05 (m, 8H), 1.05~1.88 (m, 14H), 2.06 (s, 3H), 3.20 (d, J=14Hz, 1H), 3.38 (d, J=14Hz, 1H), 4.18 (m, 1H), 4.88 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 5.13 (m, 1H), 6.43 (d, J=7Hz, 1H), 7.35 (s, 5H)

【0363】実施例109 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-4-シクロヘキシル-1-フルフリルチオ-2-ブタンोन (表-1の化合物番号238)の製造

IR (neat, cm⁻¹): 3320, 1700, 1650

NMR (CDCl₃, δ): 0.78~1.0 (m, 8H), 1.04~1.85 (m, 14H), 3.24 (d, J=13Hz, 1H), 3.35 (d, J=13Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.10 (m, 1H), 4.78 (m, 1H), 5.07 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 6.22 (d, J=3.2Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.38 (d, J=8Hz, 1H), 7.35 (s, 5H),

7.39 (m, 1H)

【0364】実施例110 (s)-4-シクロヘキシル-1-フルフリルチオ-3-((s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノバレリルアミノ)-2-ブタンोन (表-1の化合物番号240)の製造

IR (neat, cm⁻¹): 3310, 1710, 1650

NMR (CDCl₃, δ): 0.88~1.07 (m, 8H), 1.07~1.88 (m, 14H), 3.28 (d, J=15Hz, 1H), 3.36 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.53 (s, 2H), 4.57 (m, 1H), 4.80 (m, 1H), 6.21 (d, J=3.2Hz, 1H), 6.32 (m, 1H), 6.48 (d, J=8Hz, 1H), 6.87~6.99 (m, 3H), 7.05 (t, J=8Hz, 1H), 7.30~7.40 (m, 3H)

【0365】実施例111 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-メルカプト-4-フェニル-2-ブタンोन (表-1の化合物番号242)の製造

融点: 171℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3320, 1720, 1690, 1655

NMR (CDCl₃, δ): 0.80~1.0 (m, 6H), 1.30~1.70 (m, 3H), 2.92 (d, J=7.6Hz, 14Hz, 1H), 3.03~3.25 (m, 2H), 3.38 (d, J=15Hz, 1H), 4.13 (m, 1H), 4.85 (m, 1H), 4.95~5.18 (m, 2H), 5.25 (m, 1H), 6.76 (d, J=7Hz, 1H), 7.05~7.45 (m, 10H)

【0366】実施例112 (s)-3-((s)-2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-メチルチオ-4-フェニル-2-ブタンोन (表-1の化合物番号243)の製造

融点: 117~118℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3360, 1705, 1660

NMR (CDCl₃, δ): 0.85~1.05 (m, 6H), 1.25~1.70 (m, 3H), 1.44 (s, 9H), 1.98 (s, 3H), 2.95~3.25 (m, 4H), 4.04 (m, 1H), 4.77 (m, 1H), 5.06 (m, 1H), 6.67 (m, 1H), 7.15~7.38 (m, 5H)

【0367】実施例113 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-メチルチオ-4-フェニル-2-ブタンोन (表-1の化合物番号244)の製造

融点: 81~91℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3340, 3290, 172

0, 1683, 1652

NMR (CDCl₃, δ): 0.89 (d, J=5.8 Hz, 6H), 1.30~1.65 (m, 3H), 1.99 (s, 3H), 2.90~3.25 (m, 4H), 4.10 (m, 1H), 4.95~5.15 (m, 2H), 5.10 (s, 2H), 6.55 (m, 1H), 7.08~7.43 (m, 10H)

【0368】実施例114 (s)-3-[(s)-N-メチル-2-(ベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-メチルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号245) の製造

IR (neat, cm⁻¹): 3300, 1720, 1640

NMR (CDCl₃, δ): 0.85~1.0 (m, 6H), 1.20~1.82 (m, 3H), 2.0 (s, 3H), 2.84 (s, 3H), 2.97 (d, J=14 Hz, 1H), 3.0 (d, J=14 Hz, 1H), 3.26 (d, J=14 Hz, 1H), 3.35 (d, J=14 Hz, 1H), 4.54 (m, 1H), 4.90 (m, 1H), 5.07 (s, 2H), 5.26 (d, J=8 Hz, 1H), 7.15~7.35 (m, 10H)

【0369】実施例115 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-メチルスルフィニル-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号248) の製造

融点: 97~102℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3320, 1715, 1685, 1648

NMR (CDCl₃, δ): 0.70~0.95 (m, 6H), 1.10~1.70 (m, 3H), 2.84 (s, 2.1H), 2.87 (s, 0.9H), 2.80~3.03 (m, 3H), 3.13~3.45 (m, 2H), 3.50~3.75 (m, 1H), 4.0~4.20 (m, 1H), 4.28~4.88 (m, 2H), 4.95~5.10 (m, 1H), 5.09 (s, 1.4H), 5.13 (s, 0.6H), 7.10~7.55 (m, 10H)

【0370】実施例116 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-メチルスルホニル-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号249) の製造

融点: 142~144℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3400, 3200, 1718, 1652

NMR (DMSO-d₆, δ): 0.78 (d, J=8.4 Hz, 3H), 0.82 (d, J=8.4 Hz, 3H), 1.15~1.65 (m, 3H), 2.78 (m, 1H), 3.06 (s, 3H), 3.18 (m,

1H), 3.34 (s, 2H), 3.95 (m, 1H), 4.40~4.60 (m, 2H), 5.01 (s, 2H), 7.13~7.58 (m, 10H), 8.50 (d, J=8 Hz, 1H)

【0371】実施例117 (s)-3-((s)-2-アミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-メチルチオ-4-フェニル-2-ブタノン 塩酸塩 (表-1の化合物番号250) の製造

融点: 141℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3400, 1698, 1658

NMR (DMSO-d₆, δ): 0.85 (d, J=2.4 Hz, 3H), 0.87 (d, J=2.3 Hz, 3H), 1.45~1.70 (m, 3H), 1.97 (s, 3H), 2.88 (dd, J=8.8 Hz, 14 Hz, 1H), 3.16 (dd, J=5.1 Hz, 14 Hz, 1H), 3.43 (d, J=15 Hz, 1H), 3.53 (d, J=15 Hz, 1H), 3.75 (m, 1H), 4.77 (m, 1H), 7.15~7.35 (m, 5H), 8.28 (s, 3H), 9.11 (d, J=7.3 Hz, 1H)

【0372】実施例118 (s)-3-((s)-2-アセチルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-メチルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号251) の製造

融点: 118~120℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3320, 1720, 1645

NMR (CDCl₃, δ): 0.89 (d, J=4.0 Hz, 3H), 0.91 (d, J=4.1 Hz, 3H), 1.35~1.70 (m, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.99 (s, 3H), 2.90~3.25 (m, 4H), 4.40 (m, 1H), 5.06 (q, J=6.8 Hz, 1H), 5.83 (d, J=7 Hz, 1H), 6.77 (d, J=7 Hz, 1H), 7.15~7.38 (m, 5H)

【0373】実施例119 (s)-3-[(s)-4-メチル-2-(3-フェニルプロピオニルアミノ)バレリルアミノ]-1-メチルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号254) の製造

融点: 104~107℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3320, 3275, 1715, 1640

NMR (CDCl₃, δ): 0.83 (d, J=3.8 Hz, 3H), 0.85 (d, J=3.9 Hz, 3H), 1.25~1.65 (m, 3H), 1.99 (s, 3H), 2.40~2.58 (m, 2H), 2.85~3.22 (m, 6H), 4.37 (m, 1H), 5.07 (q, J=7.2 Hz, 1H), 5.61 (d, J=7.6 Hz, 1H), 6.64 (d, J=

7. 6 Hz, 1H), 7. 10~7. 35 (m, 10 H)

【0374】実施例120 (s)-3-[(s)-4-メチル-2-(1-ナフチルアセチルアミノ)パレリルアミノ]-1-メチルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号256)の製造

融点: 126~129℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1720, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.55~0.68 (m, 6H), 0.98~1.45 (m, 3H), 1.99 (s, 3H), 2.84 (m, 1H), 3.0~3.20 (m, 3H), 3.90~4.10 (m, 2H), 4.30 (m, 1H), 4.94 (m, 1H), 5.38 (d, $J=8\text{Hz}$, 0.7H), 5.50 (d, $J=8\text{Hz}$, 0.3H), 6.53 (m, 1H), 7.03~7.54 (m, 9H), 7.78~7.92 (m, 3H)

【0375】実施例121 (s)-3-((s)-4-メチル-2-(2-ナフチルアセチルアミノ)パレリルアミノ)-1-メチルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号257)の製造

融点: 112~114℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1730, 1645

NMR (CDCl_3 , δ): 0.73~0.83 (m, 6H), 1.20~1.60 (m, 3H), 1.97 (s, 0.9H), 1.98 (s, 2.1H), 2.96 (m, 1H), 3.04~3.20 (m, 3H), 3.62~3.75 (m, 2H), 4.37 (m, 1H), 5.01 (q, $J=6.7\text{Hz}$, 1H), 5.62 (d, $J=8\text{Hz}$, 0.7H), 5.70 (d, $J=8\text{Hz}$, 0.3H), 6.61 (m, 1H), 7.05~7.19 (m, 2H), 7.22~7.35 (m, 4H), 7.40~7.56 (m, 2H), 7.63~7.72 (m, 1H), 7.75~7.90 (m, 3H)

【0376】実施例122 (s)-3-((s)-4-メチル-2-フェニルスルホニルアミノ)パレリルアミノ)-1-メチルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号262)の製造

融点: 133~136℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 3280, 1700, 1675, 1645

NMR (CDCl_3 , δ): 0.50~0.90 (m, 6H), 1.20~1.60 (m, 3H), 1.97 (s, 1.8H), 1.98 (s, 1.2H), 2.80~3.20 (m, 4H), 3.63 (m, 1H), 4.90~5.10 (m, 2H), 6.41 (d, $J=7\text{Hz}$, 0.4H), 6.62 (d, $J=7\text{Hz}$, 0.

6H), 7.09~7.35 (m, 5H), 7.45~7.64 (m, 3H), 7.73~7.95 (m, 2H)

【0377】実施例123 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ)-1-オクチルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号268)の製造

融点: 69℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 3305, 1715, 1690, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.75~1.0 (m, 9H), 1.15~1.70 (m, 15H), 2.35 (t, $J=7.2\text{Hz}$, 2H), 2.90~3.25 (m, 4H), 4.0~4.20 (m, 1H), 4.88~5.20 (m, 2H), 5.08 (s, 2H), 6.56 (m, 1H), 7.07~7.45 (m, 10H)

【0378】実施例124 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ)-1-(2-クロロエチルチオ)-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号271)の製造

融点: 77~80℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3310, 3270, 1715, 1680, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83~1.0 (m, 6H), 1.38~1.60 (m, 3H), 2.65~2.85 (m, 2H), 3.0~3.30 (m, 4H), 3.45~3.65 (m, 2H), 4.11 (m, 1H), 4.90~5.08 (m, 2H), 5.10 (s, 2H), 6.65 (m, 1H), 7.10~7.35 (m, 10H)

【0379】実施例125 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ)-1-(2-メトキシエチルチオ)-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号272)の製造

融点: 68~69℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 3300, 1725, 1685, 1660

NMR (CDCl_3 , δ): 0.90 (d, $J=5.9\text{Hz}$, 6H), 1.30~1.75 (m, 3H), 2.61 (t, $J=6.2\text{Hz}$, 2H), 3.0 (dd, $J=6.8\text{Hz}$, 13Hz, 1H), 3.16 (dd, $J=6.8\text{Hz}$, 13Hz, 1H), 3.26 (d, $J=4.5\text{Hz}$, 2H), 3.32 (s, 3H), 3.50 (t, $J=6.2\text{Hz}$, 2H), 4.12 (m, 1H), 4.97 (m, 1H), 5.07 (d, $J=7\text{Hz}$, 1H), 5.10 (s, 2H), 6.59 (d, $J=7\text{Hz}$, 1H), 7.10~7.35 (m, 10H)

【0380】実施例126 (s)-3-((s)-2-

ーベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(2-ジメチルアミノエチルチオ)-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号275)の製造

融点: 67~69℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3320, 1710, 1655

NMR (CDCl_3 , δ): 0.90~1.0 (m, 6H), 1.20~1.75 (m, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.50~2.75 (m, 4H), 2.98 (m, 1H), 3.08~3.32 (m, 2H), 3.44 (m, 1H), 4.18 (m, 1H), 4.97~5.35 (m, 2H), 5.10 (s, 2H), 6.85 (m, 1H), 7.13~7.50 (m, 10H)

【0381】実施例127 (s)-1-(2-アセチルアミノエチルチオ)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号276)の製造

融点: 122~123℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3320, 1725, 1690, 1642

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83~0.98 (m, 6H), 1.30~1.70 (m, 3H), 1.97 (s, 3H), 2.45~2.68 (m, 2H), 2.90~3.45 (m, 6H), 4.12 (m, 1H), 4.95~5.15 (m, 2H), 5.09 (s, 2H), 6.21 (m, 1H), 6.68 (d, $J=7\text{Hz}$, 1H), 7.10~7.40 (m, 10H)

【0382】実施例128 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-ベンジルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号277)の製造

融点: 86~87℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3320, 1700, 1680, 1658

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (d, $J=6.0\text{Hz}$, 3H), 0.89 (d, $J=6.1\text{Hz}$, 3H), 1.35~1.70 (m, 3H), 2.88~3.22 (m, 4H), 3.69 (s, 2H), 4.12 (m, 1H), 4.95~5.18 (m, 2H), 5.09 (s, 2H), 6.53 (m, 1H), 7.10~7.50 (m, 15H)

【0383】実施例129 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-4-フェニル-1-フェニルチオ-2-ブタノン(表-1の化合物番号279)の製造

融点: 105~106℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3330, 3280, 171

3, 1685, 1653

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (d, $J=6.2\text{Hz}$, 6H), 1.30~1.70 (m, 3H), 2.88~3.18 (m, 2H), 3.63 (s, 2H), 4.13 (m, 1H), 4.95~5.18 (m, 2H), 5.09 (s, 2H), 6.53 (m, 1H), 7.05~7.15 (m, 2H), 7.15~7.50 (m, 13H)

【0384】実施例130 (s)-3-ベンジロキシカルボニルアミノアセチルアミノ-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号280)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3320, 1720, 1670

NMR (CDCl_3 , δ): 2.95~3.20 (m, 2H), 3.16 (s, 2H), 3.63 (s, 2H), 3.83 (d, $J=5.7\text{Hz}$, 2H), 5.06 (q, $J=6.8\text{Hz}$, 1H), 5.12 (s, 2H), 5.30 (m, 1H), 6.18 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.53 (d, $J=7\text{Hz}$, 1H), 7.07~7.50 (m, 11H)

【0385】実施例131 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-3-メチルプチリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号282)の製造

融点: 122~125℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 3290, 1732, 1692, 1661

NMR (CDCl_3 , δ): 0.81 (d, $J=6.8\text{Hz}$, 3H), 0.90 (d, $J=6.7\text{Hz}$, 3H), 2.07 (m, 1H), 2.92~3.25 (m, 4H), 3.62 (s, 2H), 3.96 (m, 1H), 4.98~5.28 (m, 2H), 5.11 (s, 2H), 6.18 (d, $J=3.0\text{Hz}$, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.44 (d, $J=8\text{Hz}$, 1H), 7.08~7.50 (m, 11H)

【0386】実施例132 (s)-1-フルフリルチオ-3-(s)-2-イソプトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号284)の製造

融点: 89~90℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 3290, 1730, 1690, 1655

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83~0.98 (m, 12H), 1.30~1.70 (m, 3H), 1.92 (m, 1H), 2.98 (dd, $J=7.5\text{Hz}$, 14Hz, 1H), 3.08~3.25 (m, 3H), 3.63 (s, 2H), 3.83 (d, $J=6.6\text{Hz}$, 2H), 4.13 (m, 1H), 4.88 (m, 1H), 5.02 (d, $J=7.5\text{Hz}$, 1H), 6.19

(d, J=3.2 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.57 (d, J=7 Hz, 1H), 7.15 (d, J=7.7 Hz, 2H), 7.19~7.32 (m, 3H), 7.35 (m, 1H)

【0387】実施例133 (s)-3-((s)-2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号285) の製造
IR (KBr, cm^{-1}): 3320, 1705, 1690, 1655

NMR (CDCl_3 , δ): 0.89 (d, J=6.1 Hz, 3H), 0.91 (d, J=6.2 Hz, 3H), 1.30~1.75 (m, 3H), 1.43 (s, 9H), 3.01 (dd, J=7.0 Hz, 14 Hz, 1H), 3.14 (dd, J=6.8 Hz, 14 Hz, 1H), 3.16 (s, 2H), 3.62 (s, 2H), 4.08 (m, 1H), 4.75 (m, 1H), 5.02 (m, 1H), 6.18 (d, J=3.0 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.65 (d, J=7 Hz, 1H), 7.10~7.20 (m, 2H), 7.20~7.32 (m, 3H), 7.35 (m, 1H)

【0388】実施例134 (s)-3-((s)-2-シクロペンチルメトキシカルボニルアミノ-3-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号287) の製造
融点: 77~78°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 3290, 1715, 1692, 1660

NMR (CDCl_3 , δ): 0.89 (d, J=6.0 Hz, 3H), 0.91 (d, J=6.1 Hz, 3H), 1.15~1.83 (m, 11H), 2.16 (m, 1H), 3.01 (dd, J=6.5 Hz, 14 Hz, 1H), 3.07~3.25 (m, 3H), 3.63 (s, 2H), 3.93 (d, J=7.1 Hz, 2H), 4.13 (m, 1H), 4.87 (m, 1H), 5.0 (q, J=7.3 Hz, 1H), 6.18 (d, J=3.2 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.62 (d, J=7 Hz, 1H), 7.14 (d, J=6.1 Hz, 2H), 7.16~7.35 (m, 4H)

【0389】実施例135 (s)-3-((s)-2-シクロヘキシルメトキシカルボニルアミノ-3-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号288) の製造
IR (neat, cm^{-1}): 3330, 1735, 1692, 1660

NMR (CDCl_3 , δ): 0.80~1.05 (m, 8H), 1.10~1.80 (m, 12H), 3.01 (dd, J=6.8 Hz, 14 Hz, 1H), 3.07~3.25 (m, 3H), 3.63 (s, 2H), 3.

83 (d, J=7.5 Hz, 2H), 4.09 (m, 1H), 4.90 (m, 1H), 4.99 (q, J=7.5 Hz, 1H), 6.21 (d, J=2.8 Hz, 1H), 6.32 (m, 1H), 6.58 (d, J=7 Hz, 1H), 7.05~7.37 (m, 6H)

【0390】実施例136 (s)-3-((s)-2-シクロヘプチルメトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号289) の製造
融点: 77~79°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 3300, 1718, 1690, 1660

NMR (CDCl_3 , δ): 0.89 (d, J=6.0 Hz, 3H), 0.91 (d, J=6.1 Hz, 3H), 1.10~1.90 (m, 16H), 2.99 (dd, J=6.7 Hz, 15 Hz, 1H), 3.08~3.25 (m, 3H), 3.63 (s, 2H), 3.87 (d, J=5.8 Hz, 2H), 4.12 (m, 1H), 4.88 (m, 1H), 4.99 (q, J=6.7 Hz, 1H), 6.18 (d, J=3.1 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.61 (d, J=7 Hz, 1H), 7.13 (d, J=7.8 Hz, 2H), 7.18~7.38 (m, 4H)

【0391】実施例137 (s)-3-[(s)-2-(3-シクロヘキセニル)メトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号293) の製造
融点: 85~87°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 3310, 1738, 1688, 1660

NMR (CDCl_3 , δ): 0.90 (d, J=6.0 Hz, 3H), 0.91 (d, J=6.2 Hz, 3H), 1.20~2.20 (m, 10H), 3.01 (dd, J=6.8 Hz, 14 Hz, 1H), 3.08~3.29 (m, 3H), 3.63 (s, 2H), 3.96 (d, J=6.4 Hz, 2H), 4.13 (m, 1H), 4.92 (m, 1H), 5.03 (q, J=6.8 Hz, 1H), 5.60~5.76 (m, 2H), 6.19 (d, J=2.9 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.58 (d, J=7 Hz, 1H), 7.08~7.38 (m, 6H)

【0392】実施例138 (s)-3-((s)-2-シクロヘキシルオキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号296) の製造
融点: 102~103°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3330, 3270, 1718, 1681, 1660

NMR (CDCl_3 , δ): 0.89 (d, J=6.1

Hz, 3H), 0.91 (d, J=6.3 Hz, 3H), 1.35~1.93 (m, 13H), 3.01 (dd, J=6.5 Hz, 14 Hz, 1H), 3.08~3.25 (m, 3H), 3.63 (s, 2H), 4.12 (m, 1H), 4.62 (m, 1H), 4.84 (m, 1H), 5.01 (q, J=6.5 Hz, 1H), 6.18 (d, J=2.9 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.66 (d, J=7 Hz, 1H), 7.14 (d, J=6.1 Hz, 2H), 7.20~7.35 (m, 4H)

【0393】実施例139 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号297)の製造

融点: 103~105℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 3300, 1725, 1690, 1658

NMR (CDCl_3 , δ): 0.90 (d, J=6.2 Hz, 6H), 1.30~1.65 (m, 3H), 2.96 (dd, J=7.0 Hz, 14 Hz, 1H), 3.07~3.28 (m, 3H), 3.63 (s, 2H), 4.13 (m, 1H), 4.85~5.10 (m, 2H), 5.09 (s, 2H), 6.18 (d, J=3.0 Hz, 1H), 6.29 (d, J=3.0 Hz, 1H), 6.56 (d, J=7 Hz, 1H), 7.05~7.22 (m, 11H)

【0394】実施例140 (s)-3-(R)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号297)の製造

融点: 77~78℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1730, 1690, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.80~0.95 (m, 6H), 1.20~1.70 (m, 3H), 3.0 (m, 1H), 3.12~3.20 (m, 3H), 3.63 (d, J=4.2 Hz, 2H), 4.11 (m, 1H), 4.95~5.10 (m, 2H), 5.09 (s, 2H), 6.19 (d, J=2.9 Hz, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.50 (m, 1H), 7.07~7.40 (m, 11H)

【0395】実施例141 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-N-メチル-2-(ベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号298)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3320, 1720, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85~0.98 (m, 6H), 1.20~1.75 (m, 3H), 2.80

(s, 3H), 3.02 (m, 1H), 3.08 (d, J=15 Hz, 1H), 3.23 (d, J=15 Hz, 1H), 3.30 (m, 1H), 3.65 (s, 3H), 4.50 (m, 1H), 4.74 (m, 1H), 5.06 (s, 2H), 5.20 (d, J=8.5 Hz, 1H), 6.18 (d, J=3.1 Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 7.14~7.35 (m, 11H)

【0396】実施例142 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(N-メチルベンジロキシカルボニルアミノ)パレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号299)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1710, 1695, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85~0.95 (m, 6H), 1.35~1.68 (m, 3H), 2.54 (s, 2H), 2.78 (s, 1H), 2.80~2.98 (m, 1H), 3.0~3.25 (m, 3H), 3.64 (s, 0.7H), 3.67 (s, 1.3H), 4.50~4.75 (m, 1H), 4.95 (m, 1H), 5.13 (s, 2H), 6.19 (d, J=2.9 Hz, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.55 (d, J=7 Hz, 0.7H), 6.95~7.40 (m, 11.3H)

【0397】実施例143 (s)-3-[(s)-2-(2-クロロベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号301)の製造

融点: 80~85℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 3290, 1735, 1698, 1660

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83~0.98 (m, 6H), 1.35~1.70 (m, 3H), 2.98 (dd, J=7.2 Hz, 14 Hz, 1H), 3.05~3.23 (m, 3H), 3.63 (s, 2H), 4.15 (m, 1H), 4.93~5.03 (m, 2H), 5.21 (s, 2H), 6.17 (d, J=3.2 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.58 (d, J=7 Hz, 1H), 7.05~7.45 (m, 10H)

【0398】実施例144 (s)-3-[(s)-2-(4-クロロベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号303)の製造

融点: 123~124℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 3310, 1732, 1698, 1663

NMR (CDCl_3 , δ): 0.89 (d, J=6.1

Hz, 6H), 1.33~1.70 (m, 3H), 2.98 (dd, J=6.8Hz, 14Hz, 1H), 3.05~3.25 (m, 3H), 3.63 (s, 2H), 4.13 (m, 1H), 4.90~5.12 (m, 2H), 5.05 (s, 2H), 6.19 (d, J=3.2Hz, 1H), 6.27 (m, 1H), 6.53 (d, J=7Hz, 1H), 7.11 (d, J=6.7Hz, 2H), 7.15~7.38 (m, 8H)

【0399】実施例145 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフトキシカルボニルアミノ) パレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号308) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1715, 1675, 1655

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85~1.0 (m, 6H), 1.30~1.70 (m, 3H), 1.70~2.10 (m, 4H), 2.65~3.30 (m, 6H), 3.64 (s, 2H), 4.15 (m, 1H), 4.89 (d, J=7.6Hz, 1H), 5.01 (m, 1H), 5.87 (m, 1H), 6.20 (d, J=3.1Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.64 (d, J=6.2Hz, 1H), 7.10~7.36 (m, 10H)

【0400】実施例146 (s)-3-[(s)-2-(9-フルオレニルメトキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号309) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3320, 3280, 1680, 1660

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83~0.98 (m, 6H), 1.40~1.70 (m, 3H), 2.98 (m, 1H), 3.08~3.20 (m, 3H), 3.62 (s, 2H), 4.05~4.30 (m, 2H), 4.30~4.50 (m, 2H), 4.90~5.15 (m, 2H), 6.18 (m, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.52 (m, 1H), 7.10~7.50 (m, 10H), 7.58 (d, J=7.3Hz, 2H), 7.77 (d, J=7.3Hz, 2H)

【0401】実施例147 (s)-1-フルフリルチオ-3-((s)-4-メチル-2-テトラヒドロフルフリルオキシカルボニルアミノパレリルアミノ)-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号310) の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3320, 1710, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.80~1.0 (m, 6H), 1.20~1.70 (m, 5H), 1.84~2.04 (m, 2H), 2.98 (dd, J=8.2H

z, 15Hz, 1H), 3.10~3.25 (m, 3H), 3.63 (s, 2H), 3.66~4.0 (m, 3H), 4.0~4.22 (m, 3H), 4.96~5.08 (m, 2H), 6.19 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.64 (m, 1H), 7.15~7.40 (m, 6H)

【0402】実施例148 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2-テトラヒドロピラニルメトキシカルボニルアミノ) パレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号311) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1720, 1680, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.80~1.0 (m, 6H), 1.23~1.90 (m, 9H), 2.97 (dd, J=7.3Hz, 14Hz, 1H), 3.08~3.26 (m, 3H), 3.38~3.70 (m, 2H), 3.63 (s, 2H), 3.90~4.17 (m, 4H), 4.92~5.08 (m, 2H), 6.19 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.62 (d, J=7Hz, 1H), 7.05~7.40 (m, 6H)

【0403】実施例149 (s)-3-((s)-2-フルフリルオキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号312) の製造

融点: 115~118°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 3300, 1730, 1695, 1666

NMR (CDCl_3 , δ): 0.89 (d, J=6.2Hz, 6H), 1.28~1.65 (m, 3H), 3.01 (dd, J=6.5Hz, 15Hz, 1H), 3.08~3.27 (m, 3H), 3.63 (s, 2H), 4.12 (m, 1H), 4.86~5.07 (m, 2H), 5.05 (s, 2H), 6.19 (d, J=2.9Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.36 (m, 1H), 6.41 (d, J=3.2Hz, 1H), 6.54 (m, 1H), 7.13 (d, J=7.8Hz, 2H), 7.18~7.32 (m, 3H), 7.35 (m, 1H), 7.42 (s, 1H)

【0404】実施例150 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2-ピリジルメトキシカルボニルアミノ) パレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号313) の製造

融点: 93~94°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 3300, 1733, 1698, 1658

NMR (CDCl_3 , δ): 0.89 (d, J=6.4Hz, 3H), 0.91 (d, J=6.1Hz, 3

H), 1.33~1.75 (m, 3H), 2.98 (d, $J=6.5\text{ Hz}$, 1H), 3.08~3.27 (m, 3H), 3.62 (s, 2H), 4.14 (m, 1H), 4.98 (q, $J=6.5\text{ Hz}$, 1H), 5.10~5.30 (m, 1H), 5.21 (s, 2H), 6.17 (d, $J=3.2\text{ Hz}$, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.65 (d, $J=7\text{ Hz}$, 1H), 7.07~7.38 (m, 8H), 7.72 (t, $J=8.3\text{ Hz}$, 1H), 8.57 (d, $J=5.0\text{ Hz}$, 1H)

【0405】実施例151 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(3-ピリジルメトキシカルボニルアミノ) バレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号315) の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3320, 1720, 1698, 1600

NMR (CDCl_3 , δ): 0.90 (d, $J=6.2\text{ Hz}$, 6H), 1.33~1.72 (m, 3H), 2.98 (dd, $J=6.7\text{ Hz}$, 14Hz, 1H), 3.08~3.27 (m, 3H), 3.63 (s, 2H), 4.12 (m, 1H), 5.01 (q, $J=7.5\text{ Hz}$, 1H), 5.0~5.20 (m, 1H), 5.11 (s, 2H), 6.19 (d, $J=3.0\text{ Hz}$, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.53 (m, 1H), 7.13 (d, $J=7.7\text{ Hz}$, 2H), 7.18~7.37 (m, 5H), 7.68 (d, $J=8\text{ Hz}$, 1H), 8.52~8.63 (m, 2H)

【0406】実施例152 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(4-ピリジルメトキシカルボニルアミノ) バレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号317) の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3320, 1718, 1663

NMR (CDCl_3 , δ): 0.90~1.02 (m, 6H), 1.36~1.75 (m, 3H), 3.04 (dd, $J=6.7\text{ Hz}$, 14Hz, 1H), 3.07~3.24 (m, 3H), 3.63 (s, 2H), 4.13 (m, 1H), 5.03 (q, $J=6.7\text{ Hz}$, 1H), 5.10 (s, 2H), 5.30 (d, $J=7\text{ Hz}$, 1H), 6.19 (d, $J=2.9\text{ Hz}$, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.67 (d, $J=7\text{ Hz}$, 1H), 7.08~7.33 (m, 7H), 7.35 (m, 1H), 8.59 (d, $J=7.5\text{ Hz}$, 2H)

【0407】実施例153 (s)-3-((s)-2-アミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン 塩酸塩 (表-1の化合物番号323) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3400, 1700, 165

5

NMR (D_2O , δ): 0.65~0.85 (m, 6H), 1.30~1.50 (m, 3H), 2.73 (d, $J=9.2\text{ Hz}$, 14Hz, 1H), 3.02 (d, $J=7.5\text{ Hz}$, 14Hz, 1H), 3.28 (d, $J=15\text{ Hz}$, 1H), 3.42 (d, $J=15\text{ Hz}$, 1H), 3.55 (s, 2H), 3.73 (m, 1H), 4.67 (m, 1H), 6.08 (d, $J=2.8\text{ Hz}$, 1H), 6.20 (m, 1H), 6.95~7.30 (m, 5H), 7.28 (m, 1H)

【0408】実施例154 (s)-1-フルフリルチオ-3-((s)-2-イソバレリルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号325) の製造

融点: 108~115°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3310, 1715, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.93~1.06 (m, 12H), 1.40~1.75 (m, 4H), 1.95~2.20 (m, 2H), 2.98 (dd, $J=7.2\text{ Hz}$, 14Hz, 1H), 3.16 (dd, $J=6.7\text{ Hz}$, 14Hz, 1H), 3.16 (s, 2H), 3.65 (s, 2H), 4.43 (m, 1H), 4.98 (m, 1H), 5.70 (d, $J=7\text{ Hz}$, 1H), 6.18 (d, $J=2.6\text{ Hz}$, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.70 (d, $J=7\text{ Hz}$, 1H), 7.08~7.38 (m, 6H)

【0409】実施例155 (s)-3-[(s)-2-(3-シクロヘキシルプロピオニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号328) の製造

融点: 116~118°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1722, 1710, 1638

NMR (CDCl_3 , δ): 0.80~1.0 (m, 8H), 1.08~1.80 (m, 14H), 2.15 (t, $J=7.8\text{ Hz}$, 2H), 2.98 (dd, $J=7.3\text{ Hz}$, 14Hz, 1H), 3.15 (dd, $J=5.3\text{ Hz}$, 14Hz, 1H), 3.16 (s, 2H), 3.64 (s, 2H), 4.40 (m, 1H), 4.97 (q, $J=7.2\text{ Hz}$, 1H), 5.66 (d, $J=7\text{ Hz}$, 1H), 6.19 (d, $J=3.1\text{ Hz}$, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.66 (d, $J=7\text{ Hz}$, 1H), 7.13~7.38 (m, 6H)

【0410】実施例156 (s)-3-[(s)-2-(4-シクロヘキシルブチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号329) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3270, 1730, 165

0, 1640

NMR (CDCl₃, δ): 0.75~1.03 (m, 8H), 1.03~1.75 (m, 16H), 2.11 (t, J=7.8Hz, 2H), 2.98 (dd, J=7.2Hz, 14Hz, 1H), 3.11 (dd, J=6.5Hz, 14Hz, 1H), 3.16 (s, 2H), 3.64 (s, 2H), 4.41 (m, 1H), 4.98 (m, 1H), 5.67 (d, J=8Hz, 1H), 6.19 (d, J=3.0Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.69 (d, J=7Hz, 1H), 7.10~7.37 (m, 6H)

【0411】実施例157 (s)-1-フルフリルチオ-3-[4-メチル-2-(3-フェニルプロピオニルアミノ)パレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号331)の製造

融点: 117~119℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3320, 1730, 1710, 1643

NMR (CDCl₃, δ): 0.83 (d, J=6.2Hz, 3H), 0.85 (d, J=6.2Hz, 3H), 1.25~1.65 (m, 3H), 2.33~2.53 (m, 2H), 2.85~3.03 (m, 3H), 3.05~3.18 (m, 1H), 3.15 (s, 2H), 3.64 (s, 2H), 4.35 (m, 1H), 4.96 (q, J=6.7Hz, 1H), 5.53 (d, J=7Hz, 1H), 6.19 (d, J=3.3Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.58 (d, J=7Hz, 1H), 7.10~7.40 (m, 11H)

【0412】実施例158 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(4-フェニルブチリルアミノ)パレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号332)の製造

融点: 106~108℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3300, 1728, 1708, 1638

NMR (CDCl₃, δ): 0.89 (d, J=5.9Hz, 3H), 0.91 (d, J=6.1Hz, 3H), 1.40~1.65 (m, 3H), 1.85~2.05 (m, 2H), 2.14 (t, J=7.4Hz, 2H), 2.63 (t, J=7.3Hz, 2H), 2.96 (dd, J=7.4Hz, 14Hz, 1H), 3.15 (dd, J=7.5Hz, 14Hz, 1H), 3.16 (s, 2H), 3.63 (s, 2H), 4.40 (m, 1H), 4.98 (d, J=6.6Hz, 1H), 5.64 (d, J=7Hz, 1H), 6.18 (d, J=3.2Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.63 (d, J=7Hz, 1H), 7.10~7.40 (m, 11H)

【0413】実施例159 (s)-1-フルフリルチ

オ-3-[(s)-4-メチル-2-(1-ナフチルアセチルアミノ)パレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号333)の製造

融点: 143~146℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3300, 1715, 1650

NMR (CDCl₃, δ): 0.64 (d, J=6.8Hz, 3H), 0.66 (d, J=6.8Hz, 3H), 0.98~1.15 (m, 2H), 1.25~1.45 (m, 1H), 2.78 (dd, J=7.9Hz, 14Hz, 1H), 3.07 (dd, J=6.5Hz, 14Hz, 1H), 3.14 (d, J=1.7Hz, 2H), 3.64 (s, 2H), 3.93 (d, J=16Hz, 1H), 4.04 (d, J=16Hz, 1H), 4.29 (m, 1H), 4.86 (m, 1H), 5.37 (d, J=7Hz, 1H), 6.19 (d, J=2.9Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.53 (d, J=8Hz, 1H), 6.95~7.10 (m, 2H), 7.20~7.30 (m, 5H), 7.30~7.40 (m, 2H), 7.45~7.60 (m, 3H), 7.87 (m, 1H)

【0414】実施例160 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2-ナフチルアセチルアミノ)パレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号334)の製造

融点: 123~125℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3320, 3300, 1715, 1640

NMR (CDCl₃, δ): 0.73~0.90 (m, 6H), 1.20~1.70 (m, 3H), 2.91 (dd, J=7.7Hz, 14Hz, 1H), 3.09 (dd, J=7.7Hz, 14Hz, 1H), 3.14 (s, 2H), 3.63 (s, 2H), 3.69 (d, J=3.1Hz, 2H), 4.37 (m, 1H), 4.93 (m, 1H), 5.60 (d, J=8.3Hz, 1H), 6.18 (d, J=3.1Hz, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.62 (d, J=7.5Hz, 1H), 7.05~7.16 (m, 2H), 7.20~7.35 (m, 5H), 7.45~7.55 (m, 2H), 7.67 (s, 1H), 7.74~7.90 (m, 3H)

【0415】実施例161 (s)-3-((s)-2-シンナモイルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号335)の製造

融点: 141~143℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3300, 1730, 1710, 1650, 1623

NMR (CDCl₃, δ): 0.93 (d, J=4.3Hz, 6H), 1.43~1.78 (m, 3H), 2.

95 (dd, J=7.5 Hz, 15 Hz, 1H), 3.15 (dd, J=7.5 Hz, 15 Hz, 1H), 3.19 (s, 2H), 3.65 (s, 2H), 4.59 (m, 1H), 5.0 (q, J=6.6 Hz, 1H), 5.94 (d, J=8 Hz, 1H), 6.19 (d, J=3.3 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.35 (d, J=16 Hz, 1H), 6.82 (d, J=8 Hz, 1H), 7.10~7.30 (m, 5H), 7.30~7.45 (m, 4H), 7.45~7.55 (m, 2H), 7.63 (d, J=16 Hz, 1H)

【0416】実施例162 (s)-3-[(s)-2-(3-ベンゾチエニルアセチルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号345) の製造

融点: 150~153℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1710, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.65~0.80 (m, 6H), 1.13~1.28 (m, 2H), 1.35~1.55 (m, 1H), 2.83 (dd, J=7.7 Hz, 18 Hz, 1H), 3.07 (dd, J=7.7 Hz, 18 Hz, 1H), 3.14 (s, 2H), 3.63 (s, 2H), 3.78 (s, 2H), 4.30~4.45 (m, 1H), 4.59 (q, J=6.7 Hz, 1H), 5.68 (d, J=8 Hz, 1H), 6.18 (d, J=3.2 Hz, 1H), 6.27~6.34 (m, 1H), 6.63 (d, J=8 Hz, 1H), 7.05~7.15 (m, 2H), 7.20~7.48 (m, 7H), 7.65~7.78 (m, 1H), 7.85~7.97 (m, 1H)

【0417】実施例163 (s)-3-((s)-2-シクロヘキシルオキシアセチルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号347) の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1700, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87~0.92 (m, 6H), 1.18~1.90 (m, 13H), 2.97 (dd, J=7.6 Hz, 14 Hz, 1H), 3.14 (dd, J=6.3 Hz, 14 Hz, 1H), 3.14 (d, J=15 Hz, 1H), 3.21 (d, J=15 Hz, 1H), 3.28 (m, 1H), 3.64 (s, 2H), 3.86 (d, J=16 Hz, 1H), 3.95 (d, J=16 Hz, 1H), 4.39 (m, 1H), 4.97 (q, J=7.5 Hz, 1H), 6.19 (d, J=2.9 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.76 (d, J=8 Hz, 1H), 6.80 (d, J=8 Hz, 1H), 7.13~7.36 (m, 6H)

【0418】実施例164 (s)-1-フルフリルチ

オ-3-((s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノパレリルアミノ)-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号348) の製造

融点: 91~95℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 3270, 1735, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.80~0.95 (m, 6H), 1.30~1.75 (m, 3H), 2.95 (dd, J=7.7 Hz, 14 Hz, 1H), 3.14 (dd, J=6.4 Hz, 14 Hz, 1H), 3.19 (d, J=1.9 Hz, 2H), 3.66 (s, 2H), 4.39 (d, J=15 Hz, 1H), 4.47 (m, 1H), 4.49 (d, J=15 Hz, 1H), 5.0 (q, J=7.4 Hz, 1H), 6.20 (d, J=2.9 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.60 (d, J=7 Hz, 1H), 6.73 (d, J=8 Hz, 1H), 6.91 (d, J=8.8 Hz, 2H), 7.0~7.36 (m, 9H)

【0419】実施例165 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2-フェノキシプロピオニルアミノ)パレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号349) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3280, 1710, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.75 (d, J=6.5 Hz, 3H), 0.89 (d, J=6.6 Hz, 1.5H), 0.91 (d, J=6.6 Hz, 1.5H), 1.05~1.70 (m, 6H), 2.76 (dd, J=7.9 Hz, 14 Hz, 0.5H), 2.93~3.20 (m, 3.5H), 3.64 (s, 2H), 4.37 (m, 1H), 4.67 (m, 1H), 4.87 (q, J=7.3 Hz, 0.5H), 4.99 (q, J=7.3 Hz, 0.5H), 6.19 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.42 (d, J=8 Hz, 0.5H), 6.62~6.67 (m, 1.5H), 6.86~6.93 (m, 2H), 6.99~7.06 (m, 2H), 7.13~7.36 (m, 7H)

【0420】実施例166 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2-フェノキシブチリルアミノ)パレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号350) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3260, 1720, 1705, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.73 (d, J=6.5 Hz, 3H), 0.80~0.96 (m, 3H), 0.96~1.10 (m, 3H), 1.20~1.65 (m, 3H), 1.75~2.05 (m, 2H), 2.73 (dd, J=8.1 Hz, 14 Hz, 0.5H), 2.86~3.20 (m, 1.5H), 3.14 (s, 2H), 3.63 (s, 2H), 4.37 (m, 1

H), 4.53 (m, 1H), 4.85 (q, J=5.0 Hz, 0.5H), 4.99 (q, J=5.0 Hz, 0.5H), 6.19 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.43 (d, J=8 Hz, 0.5H), 6.52 (d, J=8 Hz, 0.5H), 6.55 (d, J=8 Hz, 0.5H), 6.64 (d, J=8 Hz, 0.5H), 6.84~6.96 (m, 2H), 6.96~7.05 (m, 2H), 7.05~7.40 (m, 7H)

【0421】実施例167 (s)-3-[(s)-2-(2-クロロフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号354) の製造
融点: 99~102℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1710, 1670, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85~0.95 (m, 6H), 1.42~1.75 (m, 3H), 2.97 (dd, J=7.5 Hz, 14 Hz, 1H), 3.16 (dd, J=5.3 Hz, 14 Hz, 1H), 3.16 (d, J=15 Hz, 1H), 3.23 (d, J=15 Hz, 1H), 3.65 (s, 2H), 4.24 (m, 1H), 4.43 (d, J=15 Hz, 1H), 4.51 (d, J=15 Hz, 1H), 5.02 (q, J=7.5 Hz, 1H), 6.19 (d, J=2.9 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.67 (d, J=8 Hz, 1H), 6.88 (d, J=8 Hz, 1H), 6.95~7.45 (m, 10H)

【0422】実施例168 (s)-3-[(s)-2-(4-クロロフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号356) の製造
融点: 116~117℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 3250, 1730, 1670, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83~0.96 (m, 6H), 1.45~1.70 (m, 3H), 2.96 (dd, J=7.6 Hz, 14 Hz, 1H), 3.11 (dd, J=6.4 Hz, 14 Hz, 1H), 3.19 (s, 2H), 3.66 (s, 2H), 4.35 (d, J=15 Hz, 1H), 4.46 (d, J=15 Hz, 1H), 4.44 (m, 1H), 5.01 (dd, J=7.5 Hz, 14 Hz, 1H), 6.20 (m, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.58 (d, J=8 Hz, 1H), 6.71 (d, J=9 Hz, 1H), 6.80~6.86 (m, 2H), 7.11~7.36 (m, 8H)

【0423】実施例169 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-2-(2-メトキシフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-4-フェ

ニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号361) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3280, 1705, 1665, 1645

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (d, J=6.7 Hz, 3H), 0.89 (d, J=6.7 Hz, 3H), 1.39~1.71 (m, 3H), 2.91 (dd, J=7.7 Hz, 14 Hz, 1H), 3.10 (dd, J=7.7 Hz, 14 Hz, 1H), 3.13 (d, J=17 Hz, 1H), 3.21 (d, J=17 Hz, 1H), 3.64 (s, 2H), 3.86 (s, 3H), 4.42 (m, 1H), 4.45 (d, J=15 Hz, 1H), 4.55 (d, J=15 Hz, 1H), 4.95 (q, J=6.4 Hz, 1H), 4.85~5.05 (m, 1H), 6.20 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.70 (d, J=7.1 Hz, 1H), 6.90~7.0 (m, 3H), 7.0~7.40 (m, 7H)

【0424】実施例170 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(1-ナフトキシアセチルアミノ)パレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号364) の製造

融点: 118~120℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1730, 1670, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.75~1.03 (m, 6H), 1.38~1.65 (m, 3H), 2.95 (dd, J=7.8 Hz, 14 Hz, 1H), 3.15 (dd, J=6.4 Hz, 14 Hz, 1H), 3.19 (s, 2H), 3.66 (s, 2H), 4.50 (m, 1H), 4.61 (d, J=15 Hz, 1H), 4.69 (d, J=15 Hz, 1H), 5.04 (q, J=7.0 Hz, 1H), 6.20 (d, J=3.1 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.62 (d, J=7.1 Hz, 1H), 6.70~6.90 (m, 2H), 7.0~7.65 (m, 10H), 7.84 (m, 1H), 8.18 (m, 1H)

【0425】実施例171 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2-ナフトキシアセチルアミノ)パレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号365) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1710, 1675, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.86 (d, J=6.1 Hz, 6H), 1.45~1.70 (m, 3H), 2.95 (dd, J=7.6 Hz, 14 Hz, 1H), 3.12 (dd, J=6.5 Hz, 14 Hz, 1H), 3.18 (d, J=1.8 Hz, 2H), 3.66 (s, 2H), 4.50 (m, 1H), 4.52 (d, J=15 Hz, 1H), 4.61 (d, J=15 Hz, 1H),

5. 0 (q, J=6. 5 Hz, 1H), 6. 20 (m, 1H), 6. 29 (m, 1H), 6. 62 (d, J=8 Hz, 1H), 6. 79 (d, J=8. 5 Hz, 1H), 7. 10~7. 30 (m, 7H), 7. 30~7. 52 (m, 3H), 7. 70~7. 90 (m, 3H)

【0426】実施例172 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシアセチルアミノ-4-メチルバレリルアミノ-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号366)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 3310, 1690, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 89 (d, J=5. 7 Hz, 3H), 0. 91 (d, J=5. 7 Hz, 3H), 1. 46~1. 70 (m, 3H), 2. 96 (dd, J=7. 7 Hz, 14 Hz, 1H), 3. 14 (dd, J=6. 4 Hz, 14 Hz, 1H), 3. 17 (d, J=2. 7 Hz, 2H), 3. 64 (s, 2H), 3. 88 (d, J=14 Hz, 1H), 3. 96 (d, J=14 Hz, 1H), 4. 41 (m, 1H), 4. 55 (s, 2H), 4. 98 (q, J=6. 6 Hz, 1H), 6. 19 (m, 1H), 6. 29 (m, 1H), 6. 69 (d, J=8 Hz, 1H), 6. 78 (d, J=8 Hz, 1H), 7. 10~7. 42 (m, 11H)

【0427】実施例173 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2-テトラヒドロピランオキシアセチルアミノ)バレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号370)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1710, 1660

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 85~0. 95 (m, 6H), 1. 40~1. 88 (m, 9H), 2. 97 (m, 1H), 3. 13 (m, 1H), 3. 19 (m, 2H), 3. 50 (m, 1H), 3. 64 (s, 2H), 3. 78 (m, 1H), 3. 91~4. 20 (m, 2H), 4. 42 (m, 1H), 4. 55 (m, 1H), 4. 97 (m, 1H), 6. 19 (m, 1H), 6. 29 (m, 1H), 6. 30~6. 85 (m, 2H), 7. 10~7. 36 (m, 6H)

【0428】実施例174 (s)-3-[(s)-2-(2-ベンゾフランカルボニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号382)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1720, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 90~1. 0 (m, 6H), 1. 55~1. 80 (m, 3H), 2. 97 (d, J=7. 6 Hz, 14 Hz, 1H), 3. 13 (d,

J=6. 4 Hz, 14 Hz, 1H), 3. 20 (s, 2H), 3. 66 (s, 2H), 4. 63 (m, 1H), 5. 04 (q, J=7. 4 Hz, 1H), 6. 20 (m, 1H), 6. 29 (m, 1H), 6. 68 (d, J=8 Hz, 1H), 6. 82 (d, J=8 Hz, 1H), 7. 02~7. 20 (m, 5H), 7. 27~7. 36 (m, 2H), 7. 40~7. 55 (m, 3H), 7. 70 (d, J=7. 9 Hz, 1H)

【0429】実施例175 (s)-3-[(s)-2-(2-クロマニルカルボニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号384)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1730, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 78~0. 85 (m, 3H), 0. 93 (d, J=6. 3 Hz, 1. 5H), 0. 95 (d, J=6. 3 Hz, 1. 5H), 1. 22~1. 78 (m, 3H), 1. 78~2. 15 (m, 1H), 2. 28~2. 45 (m, 1H), 2. 66~3. 13 (m, 4H), 3. 13~3. 20 (m, 2H), 3. 63 (s, 1H), 3. 65 (s, 1H), 4. 35~4. 54 (m, 2H), 4. 90~5. 08 (m, 1H), 6. 18~6. 22 (m, 1H), 6. 30~6. 34 (m, 1H), 6. 51 (d, J=8 Hz, 0. 5H), 6. 70 (d, J=8 Hz, 0. 5H), 6. 76 (d, J=9 Hz, 0. 5H), 6. 83 (d, J=8 Hz, 0. 5H), 6. 87~6. 94 (m, 2H), 7. 04~7. 36 (m, 8H)

【0430】実施例176 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(4-オキソ-4H-1-ベンゾピラン-2-イルカルボニルアミノ)バレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号386)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3320, 1710, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 95~0. 98 (m, 6H), 1. 62~1. 80 (m, 3H), 2. 98 (dd, J=7. 5 Hz, 14 Hz, 1H), 3. 16 (dd, J=6. 4 Hz, 14 Hz, 1H), 3. 21 (s, 2H), 3. 64 (s, 2H), 4. 62 (m, 1H), 5. 08 (q, J=6. 6 Hz, 1H), 6. 20 (m, 1H), 6. 30 (m, 1H), 6. 56 (d, J=8 Hz, 1H), 7. 06~7. 26 (m, 7H), 7. 36 (m, 1H), 7. 44~7. 60 (m, 2H), 7. 70~7. 82 (m, 1H), 8. 24 (dd, J=1. 7 Hz, 7. 9 Hz, 1H)

【0431】実施例177 (s)-3-[(s)-2-(3-ベンジルウレイド)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号388)の製造

融点: 95~97℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3310, 1708, 1650, 1628

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (d, $J=4.9$ Hz, 6H), 1.30~1.70 (m, 3H), 2.93 (dd, $J=6.5$ Hz, 14 Hz, 1H), 2.98~3.19 (m, 3H), 3.58 (s, 2H), 4.17~4.45 (m, 3H), 4.87 (q, $J=6.5$ Hz, 1H), 5.17~5.35 (m, 2H), 6.16 (d, $J=3.1$ Hz, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.95~7.38 (m, 12H)

【0432】実施例178 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-3-シクロヘキシルプロピオニルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号400) の製造

融点: 124~125℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 3310, 1735, 1690, 1655

NMR (CDCl_3 , δ): 0.78~1.0 (m, 2H), 1.0~1.45 (m, 6H), 1.45~1.80 (m, 5H), 2.83~3.24 (m, 4H), 3.62 (s, 2H), 4.16 (m, 1H), 4.99 (q, $J=6.8$ Hz, 1H), 5.10 (s, 2H), 4.95~5.07 (m, 1H), 6.18 (d, $J=2.8$ Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.58 (m, 1H), 7.03~7.42 (m, 11H)

【0433】実施例179 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-3-フェニルプロピオニルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号401) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 3260, 1725, 1685, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 2.91 (dd, $J=7.1$ Hz, 14 Hz, 1H), 2.95~3.10 (m, 5H), 3.56 (s, 2H), 4.37 (m, 1H), 4.95 (q, $J=7.4$ Hz, 1H), 5.08 (s, 2H), 5.13 (m, 1H), 6.17 (d, $J=2.5$ Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.32 (d, $J=7$ Hz, 1H), 7.0~7.04 (m, 2H), 7.10~7.35 (m, 14H)

【0434】実施例180 (s)-3-(2-ベンゾイルアミノ-2-メトキシアセチルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号404) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1730, 1670, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 3.04 (dd, $J=7.$

0 Hz, 14 Hz, 1H), 3.11~3.22 (m, 3H), 3.45 (s, 0.9H), 3.49 (s, 2.1H), 3.65 (s, 0.6H), 3.68 (s, 1.4H), 5.09 (m, 1H), 5.66 (d, $J=8$ Hz, 0.7H), 5.67 (d, $J=8$ Hz, 0.3H), 6.20 (m, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.87 (d, $J=8$ Hz, 0.3H), 7.03 (d, $J=8$ Hz, 0.7H), 7.08~7.28 (m, 7H), 7.41~7.60 (m, 3H), 7.78~7.86 (m, 2H)

【0435】実施例181 (s)-3-(2-ベンジロキシカルボニルアミノ-2-イソプロポキシアセチルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号405) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1720, 1695, 1655

NMR (CDCl_3 , δ): 1.05~1.24 (m, 6H), 2.98~3.20 (m, 2H), 3.13 (s, 1H), 3.21 (s, 1H), 3.63 (s, 1H), 3.65 (s, 1H), 3.96 (m, 1H), 4.99 (m, 1H), 5.13 (s, 2H), 5.35 (m, 1H), 5.40 (d, $J=7$ Hz, 0.5H), 5.57 (d, $J=7$ Hz, 0.5H), 6.19 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 7.07~7.40 (m, 12H)

【0436】実施例182 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルパレルアミノ)-1-(5-メトキシカルボニルフルフリルチオ)-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号413) の製造

融点: 85~93℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1740~1680, 1658

NMR (CDCl_3 , δ): 0.89 (d, $J=6.3$ Hz, 6H), 1.25~1.65 (m, 3H), 2.86~3.03 (m, 1H), 3.05~3.38 (m, 2H), 3.42 (d, $J=14$ Hz, 1H), 3.65 (s, 2H), 3.87 (s, 3H), 4.08~4.23 (m, 1H), 4.95~5.15 (m, 4H), 6.31 (d, $J=3.5$ Hz, 1H), 6.85~6.95 (m, 1H), 7.09 (d, $J=3.5$ Hz, 1H), 7.13~7.45 (m, 10H)

【0437】実施例183 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルパレルアミノ)-1-(5-クロロ-2-チエニルメチルチオ)-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号423) の製造

融点: 105~107℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 3310, 1728, 1692, 1650

NMR (CDCl₃, δ) : 0.90~1.0 (m, 6H), 1.30~1.65 (m, 3H), 2.90~3.23 (m, 4H), 3.70 (s, 2H), 4.13 (m, 1H), 4.85~5.0 (m, 2H), 5.09 (s, 2H), 6.53 (m, 1H), 6.60~6.73 (m, 2H), 7.12 (d, J=6.0 Hz, 2H), 7.15~7.40 (m, 8H)

【0438】実施例184 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-4-フェニル-1-(2-ピリジルメチルチオ)-2-ブタノン(表-1の化合物番号428)の製造

融点: 82~87℃

IR (KBr, cm⁻¹) : 3330, 3280, 1718, 1680, 1655

NMR (CDCl₃, δ) : 0.89 (d, J=6.2 Hz, 6H), 1.30~1.70 (m, 3H), 2.98 (dd, J=4.8 Hz, 14 Hz, 1H), 3.14 (dd, J=4.8 Hz, 14 Hz, 1H), 3.16 (d, J=15 Hz, 1H), 3.31 (d, J=15 Hz, 1H), 3.75 (s, 2H), 4.13 (m, 1H), 5.0 (q, J=7.4 Hz, 1H), 5.08 (s, 2H), 4.93~5.15 (m, 1H), 6.74 (d, J=7 Hz, 1H), 7.10~7.42 (m, 12H), 7.65 (dt, J=1.8 Hz, 7.7 Hz, 1H), 8.52 (d, J=4.9 Hz, 1H)

【0439】実施例185 (s)-1-(2-ベンズイミダゾリルメチルチオ)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号434)の製造

融点: 125~129℃

IR (KBr, cm⁻¹) : 3300, 1710, 1690, 1653

NMR (CDCl₃, δ) : 0.80~1.0 (m, 6H), 1.30~1.70 (m, 3H), 2.75~2.95 (m, 1H), 2.95~3.25 (m, 2H), 3.25~3.55 (m, 1H), 3.73~4.08 (m, 2H), 4.10~4.25 (m, 1H), 4.90~5.25 (m, 2H), 5.07 (s, 2H), 7.0~7.15 (m, 2H), 7.15~7.40 (m, 12H), 7.40~7.70 (m, 2H)

【0440】実施例186 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(3,5-ジメチル-4-イソオキサゾリルメチルチオ)-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号438)の製造

IR (neat, cm⁻¹) : 3320, 1720, 17

05, 1655

NMR (CDCl₃, δ) : 0.90 (d, J=5.8 Hz, 6H), 1.30~1.65 (m, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.90~3.10 (m, 4H), 3.35 (s, 2H), 4.12 (m, 1H), 4.93~5.13 (m, 2H), 5.09 (s, 2H), 6.63 (d, J=8 Hz, 1H), 7.10~7.45 (m, 10H)

【0441】実施例187 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(2-メチル-4-チアゾリルメチルチオ)-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号443)の製造

IR (neat, cm⁻¹) : 3330, 1725, 1705, 1660

NMR (CDCl₃, δ) : 0.89 (d, J=5.9 Hz, 6H), 1.30~1.70 (m, 3H), 2.68 (s, 3H), 2.95~3.07 (m, 1H), 3.07~3.30 (m, 3H), 3.69 (s, 2H), 4.05~4.20 (m, 1H), 4.93~5.20 (m, 2H), 5.09 (s, 2H), 6.58~6.78 (m, 1H), 6.94 (s, 1H), 7.08~7.50 (m, 10H)

【0442】実施例188 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(2-オキソ-4-オキサゾリジニルメチルチオ)-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号445)の製造

IR (neat, cm⁻¹) : 3330, 1705, 1695, 1655

NMR (CDCl₃, δ) : 0.78~0.95 (m, 6H), 1.20~1.75 (m, 3H), 2.40~2.62 (m, 2H), 2.93 (m, 1H), 3.01~3.22 (m, 2H), 3.37 (m, 1H), 3.84 (m, 1H), 3.99 (m, 1H), 4.12 (m, 1H), 4.38 (m, 1H), 4.92 (m, 1H), 5.09 (s, 2H), 5.56 (d, J=7 Hz, 1H), 6.42 (s, 1H), 6.95~7.22 (m, 11H)

【0443】実施例189 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-メトキシ-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号447)の製造

融点: 87~92℃

IR (KBr, cm⁻¹) : 3340, 3285, 1739, 1688, 1657

NMR (CDCl₃, δ) : 0.90 (d, J=6.2 Hz, 6H), 1.30~1.75 (m, 3H), 2.90~3.10 (m, 2H), 3.35 (s, 3H), 3.87 (d, J=18 Hz, 1H), 4.08 (d,

J=18Hz, 1H), 4.13 (m, 1H), 4.96 (m, 1H), 5.06 (m, 1H), 5.09 (s, 2H), 6.57 (m, 1H), 7.11 (d, J=7.4Hz, 2H), 7.10~7.33 (m, 3H), 7.35 (s, 5H)

【0444】実施例190 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-ジメチルアミノ-4-フェニル-2-ブタンोन(表-1の化合物番号465)の製造

融点: 81~82℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3330, 3295, 1730, 1683, 1653

NMR (CDCl_3 , δ): 0.75~1.0 (m, 6H), 1.30~1.70 (m, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 2.80~3.15 (m, 3H), 3.25 (t, J=19Hz, 1H), 4.14 (m, 1H), 4.91 (m, 1H), 5.08 (s, 2H), 5.15~5.35 (m, 1H), 6.70~6.90 (m, 1H), 7.05~7.18 (m, 2H), 7.18~7.30 (m, 3H), 7.30~7.40 (m, 5H)

【0445】実施例191 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(N-メチルフルフリルアミノ)-4-フェニル-2-ブタンोन(表-1の化合物番号479)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3320, 1728, 1685, 1550

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85~1.0 (m, 6H), 1.25~1.80 (m, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.75~2.95 (m, 1H), 2.95~3.15 (m, 2H), 3.28~3.45 (m, 1H), 3.45~3.70 (m, 2H), 4.15 (m, 1H), 4.87~5.15 (m, 2H), 5.09 (s, 2H), 6.18 (d, J=2.8Hz, 1H), 6.29 (dd, J=3.1Hz, 1.9Hz, 1H), 6.55~6.75 (m, 1H), 7.03~7.15 (m, 2H), 7.15~7.25 (m, 3H), 7.25~7.40 (m, 6H)

【0446】実施例192 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(4-メチル-1-ピペラジル)-4-フェニル-2-ブタンोन(表-1の化合物番号488)の製造

融点: 99~100℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3320, 1733, 1696, 1655

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87~1.0 (m, 6H), 1.30~1.70 (m, 3H), 2.27 (s, 3H), 2.30~2.50 (m, 8H), 2.

85~3.10 (m, 3H), 3.10~3.33 (m, 1H), 4.10 (m, 1H), 4.99 (q, J=7.4Hz, 1H), 5.09 (s, 2H), 5.0~5.20 (m, 1H), 6.60~6.90 (m, 1H), 7.15 (d, J=7.0Hz, 2H), 7.18~7.30 (m, 3H), 7.30~7.40 (m, 5H)

【0447】実施例193 3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-4-(4-フルオロフェニル)-1-フルフリルチオ-2-ブタンोन(表-1の化合物番号496)の製造

融点: 101℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1720, 1680, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.82~0.99 (m, 6H), 1.23~1.75 (m, 3H), 2.82~3.02 (m, 1H), 3.05~3.25 (m, 3H), 3.65 (s, 2H), 4.05~4.18 (m, 1H), 4.90~5.02 (m, 2H), 5.07 (s, 2H), 6.21 (d, J=3.0Hz, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.50~6.55 (m, 1H), 6.87~7.0 (m, 2H), 7.03~7.15 (m, 2H), 7.25~7.40 (m, 6H)

【0448】実施例194 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-4-(2-クロロフェニル)-1-フルフリルチオ-2-ブタンोन(表-1の化合物番号503)の製造

融点: 110℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1735, 1690, 1660

NMR (CDCl_3 , δ): 0.86 (d, J=6.0Hz, 3H), 0.88 (d, J=6.0Hz, 3H), 1.21~1.80 (m, 3H), 2.97~3.12 (m, 1H), 3.19~3.38 (m, 1H), 3.28 (s, 2H), 3.67 (s, 2H), 4.10 (m, 1H), 4.90~5.07 (m, 2H), 5.09 (d, J=3.9Hz, 2H), 6.21 (d, J=2.8Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.63 (m, 1H), 7.08~7.20 (m, 5H), 7.30~7.51 (m, 5H)

【0449】実施例195 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-4-(4-クロロフェニル)-1-メチルチオ-2-ブタンोन(表-1の化合物番号506)の製造

融点: 119~121℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3320, 3280, 1703, 1685, 1658

NMR (CDCl_3 , δ): 0.80~1.0 (m, 6

H), 1.30~1.65 (m, 3H), 1.99 (s, 3H), 2.93 (dd, J=7.0 Hz, 1H), 3.05~3.35 (m, 3H), 4.15 (m, 1H), 4.90~5.22 (m, 2H), 5.10 (s, 2H), 5.62 (d, J=7 Hz, 1H), 7.07 (d, J=8.2 Hz, 2H), 7.23 (d, J=8.2 Hz, 2H), 7.36 (s, 5H)

【0450】実施例196 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ-4-(4-クロロフェニル)-1-フルフリルチオ-4-ブタノン(表-1の化合物番号508)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 3270, 1705, 1685, 1645

NMR (CDCl_3 , δ): 0.82~0.95 (m, 6H), 1.30~1.66 (m, 3H), 2.93 (m, 1H), 3.05~3.15 (m, 3H), 3.64 (s, 2H), 4.10 (m, 1H), 4.90~5.05 (m, 2H), 5.10 (s, 2H), 6.19 (m, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.57 (m, 1H), 7.06 (d, J=8.2 Hz, 2H), 7.18~7.30 (m, 3H), 7.30~7.40 (m, 5H)

【0451】実施例197 (s)-4-(4-クロロフェニル)-1-フルフリルチオ-3-(s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノバレリルアミノ-2-ブタノン(表-1の化合物番号511)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3280, 1720, 1645

NMR (CDCl_3 , δ): 0.80~0.95 (m, 6H), 1.38~1.70 (m, 3H), 2.90 (dd, J=7.3 Hz, 14 Hz, 1H), 3.10~3.23 (m, 3H), 3.66 (s, 2H), 4.35~4.53 (m, 3H), 4.97 (m, 1H), 6.20 (m, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.63 (d, J=7 Hz, 1H), 6.73 (d, J=8 Hz, 1H), 7.88~7.95 (m, 2H), 7.0~7.15 (m, 3H), 7.20~7.40 (m, 5H)

【0452】実施例198 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ-4-(4-メトキシフェニル)-1-メチルチオ-2-ブタノン(表-1の化合物番号516)の製造

融点: 100~101°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 1730, 1705, 1683, 1662

NMR (CDCl_3 , δ): 0.89 (d, J=6.0

Hz, 6H), 1.30~1.75 (m, 3H), 1.99 (s, 3H), 2.85~3.25 (m, 4H), 3.75 (s, 3H), 4.12 (m, 1H), 4.95~5.20 (m, 2H), 5.10 (s, 2H), 6.54 (d, J=7 Hz, 1H), 6.78 (d, J=8.6 Hz, 2H), 7.06 (d, J=8.6 Hz, 2H), 7.35 (s, 5H)

【0453】実施例199 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ-4-(4-ヒドロキシフェニル)-1-メチルチオ-2-ブタノン(表-1の化合物番号520)の製造

融点: 108~111°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3440, 3340, 1725, 1683, 1658

NMR (CDCl_3 , δ): 0.89 (d, J=5.9 Hz, 6H), 1.30~1.75 (m, 3H), 1.99 (s, 3H), 2.89 (m, 1H), 2.99~3.30 (m, 3H), 4.14 (m, 1H), 4.95~5.10 (m, 2H), 5.10 (s, 2H), 5.72 (s, 1H), 6.58~6.80 (m, 1H), 6.70 (d, J=8.2 Hz, 2H), 6.98 (d, J=8.2 Hz, 2H), 7.35 (s, 5H)

【0454】実施例200 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ-1-メチルチオ-4-(2-チエニル)-2-ブタノン(表-1の化合物番号527)の製造

融点: 93~97°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 3290, 1728, 1688, 1655

NMR (CDCl_3 , δ): 0.92 (d, J=6.2 Hz, 6H), 1.35~1.75 (m, 3H), 2.0 (s, 3H), 3.14 (d, J=15 Hz, 1H), 3.23~3.50 (m, 3H), 4.18 (m, 1H), 4.93~5.13 (m, 2H), 5.11 (s, 2H), 6.70~6.85 (m, 2H), 6.90 (m, 1H), 7.14 (d, J=5.1 Hz, 1H), 7.35 (s, 5H)

【0455】実施例201 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ-1-フルフリルチオ-4-(2-チエニル)-2-ブタノン(表-1の化合物番号529)の製造

融点: 106~107°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3350, 3300, 1730, 1692, 1662

NMR (CDCl_3 , δ): 0.92 (d, J=6.0 Hz, 6H), 1.38~1.75 (m, 3H), 3.12~3.43 (m, 4H), 3.64 (s, 2H), 4.18 (m, 1H), 4.90~5.15 (m, 2

H), 5.11 (s, 2H), 6.16 (d, J=3.1 Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.67~6.88 (m, 2H), 6.89 (m, 1H), 7.13 (d, J=5.1 Hz, 1H), 7.30~7.40 (m, 6H)

【0456】実施例202 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-メチルチオ-5-フェニル-2-ペンタノン (表-1の化合物番号534) の製造

融点: 119~120℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3320, 1715, 1685, 1645

NMR (CDCl_3 , δ): 0.95 (d, J=6.2 Hz, 6H), 1.40~1.75 (m, 3H), 1.95 (m, 1H), 2.05 (s, 3H), 2.28 (m, 1H), 2.63 (t, J=7.8 Hz, 2H), 3.17 (d, J=15 Hz, 1H), 3.33 (d, J=15 Hz, 1H), 4.18 (m, 1H), 4.86 (m, 1H), 4.99 (d, J=7 Hz, 1H), 5.12 (s, 2H), 6.58 (d, J=7 Hz, 1H), 7.10~7.40 (m, 10H)

【0457】実施例203 (s)-3-((s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノバレリルアミノ)-1-メチルチオ-5-フェニル-2-ペンタノン (表-1の化合物番号536) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3260, 1720, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85~1.02 (m, 6H), 1.50~1.80 (m, 3H), 1.93 (m, 1H), 2.06 (s, 3H), 2.30 (m, 1H), 2.62 (t, J=7.6 Hz, 2H), 3.17 (d, J=14 Hz, 1H), 3.32 (d, J=14 Hz, 1H), 4.50 (m, 1H), 4.54 (s, 2H), 4.88 (m, 1H), 6.63 (d, J=7 Hz, 1H), 6.82~7.10 (m, 4H), 7.10~7.40 (m, 7H)

【0458】実施例204 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-5-フェニル-2-ペンタノン (表-1の化合物番号540) の製造

融点: 73~77℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 1704, 1680, 1658

NMR (CDCl_3 , δ): 0.94 (d, J=5.9 Hz, 6H), 1.40~1.75 (m, 3H), 1.91 (m, 1H), 2.21 (m, 1H), 2.61 (t, J=7.5 Hz, 2H), 3.15~3.35 (m, 2H), 3.70 (s, 2H), 4.16 (m, 1H), 4.78 (m, 1H), 5.02 (d, J=7.5 Hz, 1H), 5.12 (s, 2H), 6.20

(d, J=2.9 Hz, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.59 (d, J=7 Hz, 1H), 7.08~7.45 (m, 11H)

【0459】実施例205 (s)-3-((R)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-5-フェニル-2-ペンタノン (表-1の化合物番号540) の製造

融点: 107℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3320, 1725, 1690, 1645

NMR (CDCl_3 , δ): 0.95 (d, J=6.1 Hz, 6H), 1.35~2.0 (m, 4H), 2.25 (m, 1H), 2.50~2.65 (m, 2H), 3.20 (d, J=15 Hz, 1H), 3.28 (d, J=15 Hz, 1H), 3.70 (s, 2H), 4.17 (m, 1H), 4.78 (m, 1H), 5.10 (m, 1H), 5.12 (d, J=1.8 Hz, 2H), 6.20 (d, J=2.1 Hz, 1H), 6.27 (m, 1H), 6.63 (m, 1H), 7.10~7.40 (m, 11H)

【0460】実施例206 (s)-1-フルフリルチオ-3-((s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノバレリルアミノ)-5-フェニル-2-ペンタノン (表-1の化合物番号543) の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3270, 1720, 1655

NMR (CDCl_3 , δ): 0.90~0.95 (m, 6H), 1.48~1.80 (m, 3H), 1.90 (m, 1H), 2.22 (m, 1H), 2.60 (t, J=7.8 Hz, 2H), 3.22 (d, J=15 Hz, 1H), 3.30 (d, J=15 Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.50 (m, 1H), 4.54 (s, 2H), 4.78 (m, 1H), 6.21 (m, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.62 (d, J=8 Hz, 1H), 6.86 (d, J=8 Hz, 1H), 6.90~6.98 (m, 1H), 7.03 (t, J=7.3 Hz, 1H), 7.06~7.36 (m, 9H)

【0461】実施例207 3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-メチルチオ-4-(1-ナフチル)-2-ブタノン (表-1の化合物番号547) の製造

融点: 77~80℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 1700, 1685, 1665

NMR (CDCl_3 , δ): 0.78~0.90 (m, 6H), 1.20~1.65 (m, 3H), 1.92 (s, 1.5H), 1.95 (s, 1.5H), 2.93 (t, J=14 Hz, 2H), 3.52 (d, J=7.1 Hz, 2H), 4.07 (m, 1H), 4.92

(m, 1H), 5.09 (s, 2H), 5.18 (m, 1H), 6.55~6.65 (m, 1H), 7.20~7.45 (m, 7H), 7.50~7.62 (m, 2H), 7.76 (dd, J=2.7Hz, 7.8Hz, 1H), 7.86 (d, J=8.0Hz, 1H), 8.20 (d, J=7.8Hz, 1H)

【0462】実施例208 3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-(1-ナフチル)-2-ブタノン(表-1の化合物番号550)の製造

融点: 71~74℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3330, 1730, 1690, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.78~0.90 (m, 6H), 1.25~1.60 (m, 3H), 2.90~3.05 (m, 2H), 3.49 (d, J=7.1Hz, 2H), 3.57 (d, J=6.3Hz, 2H), 4.08 (m, 1H), 4.88 (m, 1H), 5.08 (s, 2H), 5.11 (m, 1H), 6.12 (m, 1H), 6.25 (m, 1H), 6.57 (d, J=7Hz, 0.5H), 6.66 (d, J=7Hz, 0.5H), 7.20~7.40 (m, 8H), 7.42~7.62 (m, 2H), 7.75 (dd, J=3.1Hz, 8.2Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.0Hz, 1H), 8.17 (d, J=8.0Hz, 1H)

【0463】実施例209 1-フルフリルチオ-3-((s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノパレリルアミノ)-4-(1-ナフチル)-2-ブタノン(表-1の化合物番号555)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3280, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.72~0.92 (m, 6H), 1.20~1.70 (m, 3H), 2.90~3.05 (m, 2H), 3.40~3.60 (m, 2H), 3.60 (s, 2H), 4.41 (m, 1H), 4.45 (s, 2H), 5.11 (m, 1H), 6.14 (m, 1H), 6.25 (m, 1H), 6.65~7.12 (m, 5H), 7.20~7.42 (m, 5H), 7.42~7.65 (m, 2H), 7.70~7.90 (m, 2H), 8.13 (t, J=8.3Hz, 1H)

【0464】実施例210 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-メチルチオ-4-(2-ナフチル)-2-ブタノン(表-1の化合物番号559)の製造

融点: 101~103℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 1730, 1690, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.65~0.76 (m, 2.4H), 0.83 (d, J=5.7Hz, 3.6

H), 1.25~1.63 (m, 3H), 1.97 (s, 1.8H), 1.99 (s, 1.2H), 3.05~3.40 (m, 4H), 4.08 (m, 1H), 4.94~5.07 (m, 3H), 5.16 (q, J=7.0Hz, 1H), 6.52 (d, J=7Hz, 0.4H), 6.68 (d, J=7Hz, 0.6H), 7.25~7.40 (m, 6H), 7.40~7.50 (m, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.70~7.85 (m, 3H)

【0465】実施例211 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-(2-ナフチル)-2-ブタノン(表-1の化合物番号563)の製造

融点: 103~104℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3330, 3300, 1710, 1690, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.70~0.80 (m, 1.8H), 0.84 (d, J=5.7Hz, 4.2H), 1.20~1.60 (m, 3H), 3.10~3.40 (m, 4H), 3.61 (s, 1.4H), 3.64 (s, 0.6H), 4.10 (m, 1H), 4.90~5.15 (m, 4H), 6.14 (m, 1H), 6.26 (m, 1H), 6.52 (d, J=7Hz, 0.3H), 6.64 (d, J=7Hz, 0.7H), 7.26~7.40 (m, 7H), 7.40~7.50 (m, 2H), 7.59 (m, 1H), 7.76~7.84 (m, 3H)

【0466】実施例212 (s)-1-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-3-メチルチオ-1-フェニル-2-プロパノン(表-1の化合物番号565)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3330, 1710, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.80~1.0 (m, 6H), 1.20~1.75 (m, 3H), 2.00 (s, 3H), 3.08 (dd, J=3.4Hz, 14Hz, 1H), 3.25 (dd, J=3.8Hz, 14Hz, 1H), 4.25 (m, 1H), 5.09 (s, 1H), 5.13 (s, 1H), 5.92 (d, J=6.3Hz, 1H), 7.17 (m, 1H), 7.25~7.45 (m, 10H)

【0467】実施例213 (s)-4-ベンジロキシ-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-メチルチオ-2-ブタノン(表-1の化合物番号571)の製造

融点: 58~70℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3340, 1723, 1688, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85~1.05 (m, 6H), 1.40~1.80 (m, 3H), 2.02

(s, 3H), 3.22 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.65 (m, 1H), 3.93 (m, 1H), 4.23 (m, 1H), 4.43 (d, J=13Hz, 1H), 4.53 (d, J=13Hz, 1H), 5.0 (m, 1H), 5.11 (s, 2H), 5.15 (m, 1H), 6.90 (m, 1H), 7.20~7.45 (m, 10H)

【0468】実施例214 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1, 5-ビス(メチルチオ)-2-ペンタノン(表-1の化合物番号584)の製造

融点: 61~67℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3320, 1715, 1682, 1642

NMR (CDCl_3 , δ): 0.93 (d, J=5.4Hz, 6H), 1.45~2.35 (m, 5H), 2.06 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 2.49 (t, J=6.9Hz, 2H), 3.24 (d, J=14Hz, 1H), 3.36 (d, J=14Hz, 1H), 4.23 (m, 1H), 4.93 (m, 1H), 5.11 (s, 2H), 5.35 (m, 1H), 6.98 (m, 1H), 7.34 (s, 5H)

【0469】実施例215 3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-5-フルフリルチオ-1-メチルチオ-2-ペンタノン(表-1の化合物番号588)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3350, 3310, 1715, 1690, 1660, 1643

NMR (CDCl_3 , δ): 0.93 (d, J=5.5Hz, 3H), 0.95 (d, J=5.5Hz, 3H), 1.45~1.93 (m, 4H), 2.05 (s, 3H), 2.13 (m, 1H), 2.50 (t, J=6.7Hz, 2H), 3.14~3.42 (m, 2H), 3.70 (s, 2H), 4.21 (m, 1H), 4.89 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 5.13 (m, 1H), 6.19 (d, J=2.9Hz, 1H), 6.32 (m, 1H), 6.77 (m, 1H), 7.30~7.40 (m, 6H)

【0470】実施例216 (s)-4-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-6-フルフリルチオ-5-オキソヘキサン酸メチルエステル(表-1の化合物番号598)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3330, 1735, 1715, 1660

NMR (CDCl_3 , δ): 0.93 (d, J=5.9Hz, 6H), 1.42~2.50 (m, 7H), 3.29 (d, J=15Hz, 1H), 3.36 (d, J=15Hz, 1H), 3.65 (s, 3H), 3.70 (s, 2H), 4.19 (m, 1H), 4.77 (m, 1H), 5.11 (s, 2H), 5.16 (m, 1

H), 6.22 (d, J=2.4Hz, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.90 (m, 1H), 7.25~7.40 (m, 6H)

【0471】実施例217 (s)-4-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-6-フルフリルチオ-5-オキソヘキサン酸(表-1の化合物番号600)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3420, 1710, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.91 (d, J=5.0Hz, 6H), 1.40~2.75 (m, 7H), 3.31 (s, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.22 (m, 1H), 4.78 (m, 1H), 5.09 (s, 2H), 5.43 (m, 1H), 6.19 (d, J=2.1Hz, 1H), 6.26 (m, 1H), 6.91 (m, 1H), 7.13~7.35 (m, 7H)

【0472】実施例218 1-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-3-フルフリルチオ-1-プロポキシ-2-プロパノン(表-1の化合物番号604)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3300, 1710, 1660

NMR (CDCl_3 , δ): 0.89 (t, J=7.5Hz, 3H), 0.95 (d, J=5.9Hz, 6H), 1.40~1.80 (m, 5H), 3.37 (d, J=15Hz, 1H), 3.50 (d, J=15Hz, 1H), 3.50~3.67 (m, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.25 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 5.14 (m, 1H), 5.76 (m, 1H), 6.20 (d, J=2.5Hz, 1H), 6.28 (m, 1H), 6.88 (d, J=9Hz, 0.7H), 6.97 (d, J=9Hz, 0.3H), 7.30~7.40 (m, 6H)

【0473】実施例219 3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-4-フェニル-1-フェニルチオ-3-ブテン-2-オン(表-1の化合物番号610)の製造

融点: 142~143℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3385, 1692, 1650

NMR (CDCl_3 , δ): 0.93 (d, J=5.2Hz, 3H), 0.96 (d, J=6.1Hz, 3H), 1.52 (m, 1H), 1.70 (m, 2H), 3.98 (s, 2H), 4.38 (m, 1H), 5.05 (d, J=6.5Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 7.09 (s, 1H), 7.20~7.48 (m, 15H), 7.88 (s, 1H)

【0474】実施例220 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-2-(3-(2-フリル)アクリロイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-ヘプ

タン (表-1の化合物番号645) の製造

IR (KBr, cm^{-1}) : 3272, 1715, 1651, 1618

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.81 (t, $J=6.7$ Hz, 3H), 0.92 (d, $J=5.6$ Hz, 6H), 1.13~1.41 (m, 4H), 1.45~1.79 (m, 4H), 1.85 (m, 1H), 3.27 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.36 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.72 (s, 2H), 4.62~4.83 (m, 2H), 6.18~6.60 (m, 6H), 7.06 (d, $J=7.7$ Hz, 1H), 7.28~7.51 (m, 3H)

【0475】実施例221 (s)-3-((s)-1-ベンジロキシカルボニル-2-ピロリジニルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号669) の製造

IR (neat, cm^{-1}) : 3320, 1720, 1680

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.86 (t, $J=6.7$ Hz, 3H), 1.10~1.39 (m, 4H), 1.55 (m, 1H), 1.75~2.10 (m, 4H), 2.21 (m, 1H), 3.03~3.38 (m, 2H), 3.38~3.63 (m, 2H), 3.63~3.78 (m, 2H), 4.36 (m, 1H), 4.67 (m, 1H), 5.18 (s, 2H), 6.22 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.58 (m, 1H), 7.22~7.45 (m, 6H)

【0476】実施例222 (s)-3-((s)-1-ベンジロキシカルボニル-2-ピロリジニルカルボニルアミノ)-1-メチルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号673) の製造

IR (neat, cm^{-1}) : 3330, 1705, 1680

NMR (CDCl_3 , δ) : 1.40~2.05 (m, 4H), 1.97 (s, 3H), 2.85~3.60 (m, 6H), 4.31 (m, 1H), 5.02 (m, 1H), 5.15 (s, 2H), 7.12 (d, $J=7.5$ Hz, 2H), 7.15~7.45 (m, 8H)

【0477】実施例223 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニル-3-パーヒドロイソキノリルカルボニルアミノ)-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号683) の製造

IR (neat, cm^{-1}) : 3350, 1690

NMR (CDCl_3 , δ) : 1.15~1.90 (m, 12H), 2.80~3.25 (m, 6H), 3.60~3.70 (m, 2H), 4.70~5.25 (m, 4H), 6.20 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.52 (m, 1H), 7.0~7.45 (m, 11H)

【0478】実施例224 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(4-メチルフェノキシアセチルアミノ)バレルルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号98) の製造

融点 93℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3279, 1707, 1660, 1649

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.86 (t, $J=6.9$ Hz, 3H), 0.92 (d, $J=4.2$ Hz, 6H), 1.13~1.41 (m, 4H), 1.44~1.81 (m, 4H), 1.89 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 3.27 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.34 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.48 (s, 2H), 4.59 (m, 1H), 4.75 (m, 1H), 6.22 (d, $J=2.9$ Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.78~6.90 (m, 3H), 6.97 (d, $J=8.4$ Hz, 1H), 7.10 (d, $J=8.4$ Hz, 2H), 7.35 (m, 1H)

【0479】実施例225 (s)-3-[(s)-2-(2,4-ジメトキシベンゾイルアミノ)-4-メチルバレルルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号154) の製造

IR (neat, cm^{-1}) : 3383, 3285, 1717, 1660, 1635

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.78 (t, $J=6.6$ Hz, 3H), 0.96 (d, $J=6.2$ Hz, 3H), 0.98 (d, $J=6.4$ Hz, 3H), 1.13~1.37 (m, 5H), 1.42~1.97 (m, 4H), 3.27 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.37 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.72 (s, 2H), 3.86 (s, 3H), 3.95 (s, 3H), 4.62~4.79 (m, 2H), 6.22 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.49 (d, $J=2.2$ Hz, 1H), 6.60 (dd, $J=8.8$ Hz, 2.2 Hz, 1H), 7.10 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 7.35 (m, 1H), 8.05 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 8.14 (d, $J=8.8$ Hz, 1H)

【0480】実施例226 (s)-3-((s)-2-シンナモイルアミノ-4-メチルバレルルアミノ)-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号163) の製造

IR (KBr, cm^{-1}) : 3272, 1715, 1649, 1618

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.82 (t, $J=6.9$ Hz, 3H), 0.96 (d, $J=5.5$ Hz, 6H), 1.15~1.43 (m, 4H), 1.45~1.79 (m, 4H), 1.83 (m, 1H), 3.29 (m, $J=15$ Hz, 1H), 3.35 (d, $J=1$

5 Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.62~4.82 (m, 2H), 6.21 (d, J=3.2 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.46 (d, J=1.6 Hz, 1H), 6.54 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.05 (d, J=7.6 Hz, 1H), 7.28~7.40 (m, 4H), 7.41~7.56 (m, 2H), 7.63 (d, J=1.6 Hz, 1H)

【0481】実施例227 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号192) の製造

融点 110~112℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3366, 3150, 1709, 1655

NMR (CDCl_3 , δ): 0.70 (d, J=7.9 Hz, 3H), 0.78~0.95 (m, 6H), 1.05~1.20 (m, 2H), 1.20~1.38 (m, 2H), 1.39~1.65 (m, 4H), 1.76 (m, 1H), 3.26 (d, J=1.5 Hz, 1H), 3.30 (d, J=1.5 Hz, 1H), 3.70 (s, 2H), 3.75 (m, 1H), 4.61 (m, 1H), 5.48 (d, J=7.8 Hz, 1H), 6.21 (d, J=2.8 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.60 (d, J=7.7 Hz, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.43~7.62 (m, 3H), 7.87 (dd, J=7.9 Hz, 1.1 Hz, 2H)

【0482】実施例228 (s)-3-[(s)-2-(2,4-ジメトキシシンナモイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号337) の製造

融点 145~147℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3271, 1728, 1645, 1607

NMR (CDCl_3 , δ): 0.91 (d, J=5.9 Hz, 3H), 0.93 (d, J=6.1 Hz, 3H), 1.45~1.78 (m, 3H), 2.94 (dd, J=1.4 Hz, 7.7 Hz, 1H), 3.12 (dd, J=1.4 Hz, 7.7 Hz, 1H), 3.16 (d, J=1.5 Hz, 1H), 3.21 (d, J=1.5 Hz, 1H), 3.64 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.87 (s, 3H), 4.57 (m, 1H), 4.96 (m, 1H), 5.84 (d, J=8.0 Hz, 1H), 6.18 (d, J=3.2 Hz, 1H), 6.29 (dd, J=3.2 Hz, 1.9 Hz, 1H), 6.41 (d, J=1.6 Hz, 1H), 6.46~6.53 (m, 2H), 6.96 (d, J=7.6 Hz, 1H), 7.11~7.31 (m, 5H), 7.34 (m, 1H), 7.39 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.79 (d, J=1.6 Hz, 1H)

【0483】実施例229 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(4-メトキシフェノキシアセチルアミノ)バレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号363) の製造

融点 94~97℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3437, 3291, 1726, 1657

NMR (CDCl_3 , δ): 0.88 (d, J=6.2 Hz, 3H), 0.89 (d, J=6.1 Hz, 3H), 1.41~1.75 (m, 3H), 2.95 (dd, J=1.4 Hz, 7.6 Hz, 1H), 3.14 (dd, J=1.4 Hz, 7.6 Hz, 1H), 3.16 (d, J=1.5 Hz, 1H), 3.21 (d, J=1.5 Hz, 1H), 3.65 (s, 2H), 3.77 (s, 3H), 4.34 (d, J=1.5 Hz, 1H), 4.44 (d, J=1.5 Hz, 1H), 4.46 (m, 1H), 4.99 (m, 1H), 6.20 (d, J=3.3 Hz, 1H), 6.29 (dd, J=3.3 Hz, 1.9 Hz, 1H), 6.24 (d, J=7.7 Hz, 1H), 6.74 (d, J=8.2 Hz, 1H), 6.84 (s, 4H), 7.09~7.28 (m, 5H), 7.35 (dd, J=1.9 Hz, 0.9 Hz, 1H)

【0484】実施例230 (s)-3-[(s)-2-(2-フルオロベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-4-フェニル-2-ブタノン (表-1の化合物番号337) の製造

融点 116℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3293, 1725, 1638, 1615

NMR (CDCl_3 , δ): 0.92 (d, J=5.6 Hz, 3H), 0.95 (d, J=5.7 Hz, 3H), 1.45~1.80 (m, 3H), 2.96 (dd, J=1.4 Hz, 7.7 Hz, 1H), 3.15 (dd, J=1.4 Hz, 7.7 Hz, 1H), 3.17 (d, J=1.5 Hz, 1H), 3.23 (d, J=1.5 Hz, 1H), 3.65 (s, 2H), 4.62 (m, 1H), 5.01 (td, J=7.5 Hz, 6.5 Hz, 1H), 6.19 (d, J=3.2 Hz, 1H), 3.29 (m, 1H), 6.75~6.92 (m, 2H), 7.08~7.39 (m, 8H), 7.52 (m, 1H), 8.06 (td, J=7.9 Hz, 1.9 Hz, 1H)

【0485】実施例231 (s)-1-(2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(3-ピリジルメチルチオアセチル)シクロプロペノン (表-1の化合物番号639) の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3326, 1713, 1680

NMR (CDCl_3 , δ): 0.91 (d, J=5.8

Hz, 3H), 0.94 (d, J=6.1 Hz, 3H), 1.03~1.40 (m, 4H), 1.41~1.83 (m, 6H), 1.83~2.07 (m, 3H), 3.24 (s, 2H), 3.71 (s, 2H), 4.12 (m, 1H), 5.05 (d, J=12 Hz, 1H), 5.15 (d, J=12 Hz, 1H), 5.33 (d, J=5.8 Hz, 1H), 6.73 (s, 1H), 7.22 (m, 1H), 7.29~7.40 (m, 5H), 7.68 (dd, J=7.8 Hz, 4.1 Hz, 1H), 8.46 (dd, J=4.8 Hz, 1.5 Hz, 1H) 8.52 (s, 1H)

【0486】実施例232 (RS)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-(3-フリルメチルチオ)-5-メチル-2-ヘキサノン(表-1の化合物番号699)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3310, 1705, 1655

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83~1.13 (m, 12H), 1.37~2.05 (m, 6H), 3.12~3.35 (m, 2H), 3.52 (s, 2H), 4.20 (m, 1H), 4.79 (m, 1H), 5.11 (s, 2H), 5.16 (m, 1H), 6.38 (m, 1H), 6.45~6.63 (m, 1H), 7.23~7.48 (m, 7H)

【0487】実施例233 (RS)-1-(3-フリルメチルチオ)-5-メチル-3-((s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノパレリルアミノ)-2-ヘキサノン(表-1の化合物番号701)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3290, 1705, 1651, 1599

NMR (CDCl_3 , δ): 0.82~1.02 (m, 12H), 1.40~1.82 (m, 6H), 3.12~3.32 (m, 2H), 3.51 (s, 1H), 3.54 (s, 1H), 4.45~4.63 (m, 3H), 4.78 (m, 1H), 6.37 (d, J=1.3 Hz, 0.5H), 6.39 (d, J=0.6 Hz, 0.5H), 6.48 (d, J=7.8 Hz, 0.5H), 6.62 (d, J=7.6 Hz, 0.5H), 6.86~6.98 (m, 3H), 7.04' m, 1H), 7.25~7.39 (m, 4H)

【0488】実施例234 (s)-1-(3-フリルメチルチオ)-3-[(s)-2-(4-メトキシフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-5-メチル-2-ヘキサノン(表-1の化合物番号703)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3293, 1708, 1651

NMR (CDCl_3 , δ): 0.82~1.03 (m, 12H), 1.39~1.81 (m, 6H), 3.19

(d, J=14 Hz, 1H), 3.29 (d, J=14 Hz, 1H), 3.54 (s, 2H), 3.77 (s, 3H), 4.46 (s, 2H), 4.55 (m, 1H), 4.78 (m, 1H), 6.39 (m, 1H), 7.61 (d, J=8.2 Hz, 1H), 6.86 (s, 4H), 6.93 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.36~7.42 (m, 2H)

【0489】実施例235 (s)-3-[(s)-2-(2,4-ジメトキシシナモイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-(3-フリルメチルチオ)-5-メチル-2-ヘキサノン(表-1の化合物番号706)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3272, 1715, 1645, 1605

NMR (CDCl_3 , δ): 0.86 (d, J=5.8 Hz, 6H), 0.95 (d, J=5.1 Hz, 6H), 1.40~1.83 (m, 6H), 3.22 (d, J=14 Hz, 1H), 3.30 (d, J=14 Hz, 1H), 3.53 (s, 2H), 3.81 (s, 6H), 4.67~4.82 (m, 2H), 6.30~6.58 (m, 5H), 7.18 (m, 1H), 7.31~7.40 (m, 3H), 7.80 (d, J=19 Hz, 1H)

【0490】実施例236 (s)-1-(3-フリルメチルチオ)-5-メチル-2-[(s)-4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルベンゾイルアミノ)パレリルアミノ]-2-ヘキサノン(表-1の化合物番号709)の製造

融点 135~147°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3299, 1717, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.90 (d, J=5.8 Hz, 6H), 0.99 (d, J=5.7 Hz, 6H), 1.41~1.83 (m, 6H), 3.20 (d, J=15 Hz, 1H), 3.29 (d, J=15 Hz, 1H), 3.54 (s, 2H), 4.69 (m, 1H), 4.83 (m, 1H), 6.39 (m, 1H), 6.46 (d, J=8.0 Hz, 1H), 6.69 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.37~7.41 (m, 2H), 7.71 (d, J=8.3 Hz, 2H), 7.89 (d, J=8.3 Hz, 2H)

【0491】実施例237 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-2-(2,6-ジメチルフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号713)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3306, 1707, 1660, 1651

NMR (CDCl_3 , δ): 0.88 (t, J=7.0 Hz, 3H), 0.97~1.07 (m, 6H), 1.19~1.41 (m, 4H), 1.45~1.83

(m, 4H), 1.90 (m, 1H), 2.26 (s, 6H), 3.28 (d, J=15Hz, 1H), 3.36 (d, J=15Hz, 1H), 3.72 (s, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.62 (m, 1H), 4.80 (m, 1H), 6.22 (d, J=3.0Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.71 (d, J=7.5Hz, 1H), 6.92~7.07 (m, 3H), 7.26 (d, J=7.9Hz, 1H), 7.36 (m, 1H)

【0492】実施例238 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2-トリフルオロメチルフェノキシアセチルアミノ)パレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号715) の製造
IR (KBr, cm^{-1}): 3285, 1721, 1672, 1647

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, J=6.9Hz, 3H), 0.93 (d, J=6.2Hz, 3H), 0.95 (d, J=6.1Hz, 3H), 1.15~1.40 (m, 4H), 1.44~1.81 (m, 4H), 1.92 (m, 1H), 3.26 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.72 (s, 2H), 4.49 (m, 1H), 4.57 (d, J=15Hz, 1H), 4.64 (d, J=15Hz, 1H), 4.75 (m, 1H), 6.22 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.65 (d, J=7.7Hz, 1H), 6.87~7.05 (m, 2H), 7.13 (dd, J=7.6Hz, 7.6Hz, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.55 (dd, J=7.7Hz, 7.7Hz, 1H), 7.63 (d, J=7.8Hz, 1H)

【0493】実施例239 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(3-トリフルオロメチルフェノキシアセチルアミノ)パレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号716) の製造
融点 95~96°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3285, 1707, 1671, 1647

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, J=6.9Hz, 3H), 0.95 (d, J=6.0Hz, 6H), 1.09~1.41 (m, 4H), 1.43~1.81 (m, 4H), 1.90 (m, 1H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.55 (s, 2H), 4.63 (m, 1H), 4.76 (m, 1H), 6.22 (d, J=3.1Hz, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.59 (d, J=7.2Hz, 1H), 6.94 (d, J=7.2Hz, 1H), 7.04~7.23 (m, 2H), 7.35 (m, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.45 (dd, J=8.1Hz, 8.1Hz, 1H)

【0494】実施例240 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルフェノキシアセチルアミノ)パレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号717) の製造
融点 69~70°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3294, 1705, 1649, 1616

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85 (t, J=7.0Hz, 3H), 0.93 (d, J=6.1Hz, 6H), 1.17~1.41 (m, 4H), 1.45~1.76 (m, 4H), 1.86 (m, 1H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.34 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.47~4.62 (m, 3H), 4.78 (m, 1H), 6.22 (m, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.55 (d, J=7.7Hz, 1H), 6.90 (d, J=8.2Hz, 1H), 7.02 (d, J=8.6Hz, 2H), 7.36 (m, 1H), 7.59 (d, J=8.6Hz, 2H)

【0495】実施例241 (s)-3-[(s)-2-(2-フルオロシンナモイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号718) の製造
融点 120°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3270, 1734, 1659, 1620

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83 (t, J=6.7Hz, 3H), 0.96 (d, J=5.8Hz, 6H), 1.17~1.39 (m, 4H), 1.43~1.79 (m, 4H), 1.90 (m, 1H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.35 (d, J=15Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.62~4.82 (m, 2H), 6.21 (d, J=3.1Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.38 (d, J=8.4Hz, 1H), 6.57 (d, J=16Hz, 1H), 6.87 (d, J=7.5Hz, 1H), 7.03~7.20 (m, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.47 (ddd, J=7.6Hz, 7.6Hz, 1.7Hz, 1H), 7.71 (d, J=16Hz, 1H)

【0496】実施例242 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルシンナモイルアミノ)パレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号721) の製造
融点 112°C

IR (KBr, cm^{-1}): 3304, 1720, 1647, 1618

NMR (CDCl_3 , δ): 0.82 (t, J=6.9Hz, 3H), 0.96 (d, J=5.8Hz, 6H), 1.17~1.38 (m, 5H), 1.43~

1. 78 (m, 3H), 1. 83 (m, 1H), 3. 27 (d, J=14Hz, 1H), 3. 35 (d, J=14Hz, 1H), 3. 73 (s, 2H), 4. 65~4. 82 (m, 2H), 6. 22 (d, J=3. 2Hz, 1H), 6. 29 (m, 1H), 6. 55 (d, J=16Hz, 1H), 6. 87 (d, J=8. 4Hz, 1H), 7. 07 (d, J=7. 6Hz, 1H), 7. 35 (m, 1H), 7. 43~7. 59 (m, 4H), 7. 62 (d, J=16Hz, 1H)

【0497】実施例243 (s)-3-[(s)-2-(2, 3-ジメトキシベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号722)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3296, 1715, 1680, 1643

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 79 (t, J=6. 8Hz, 3H), 0. 83~1. 08 (m, 6H), 1. 15~1. 40 (m, 5H), 1. 43~1. 98 (m, 4H), 3. 27 (d, J=15Hz, 1H), 3. 36 (d, J=15Hz, 1H), 3. 72 (s, 2H), 3. 90 (s, 3H), 3. 92 (s, 3H), 4. 61~4. 79 (m, 2H), 6. 22 (d, J=3. 1Hz, 1H), 6. 29 (m, 1H), 6. 95 (d, J=7. 5Hz, 1H), 7. 06 (dd, J=8. 2Hz, 1. 5Hz, 1H), 7. 18 (dd, J=7. 8Hz, 7. 7Hz, 1H), 7. 35 (m, 1H), 7. 67 (dd, J=7. 8Hz, 1. 5Hz, 1H), 8. 37 (d, J=7. 7Hz, 1H)

【0498】実施例244 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(2, 4, 5-トリメトキシベンゾイルアミノ)パレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号724)の製造

融点 80~81℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3296, 1722, 1626

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 79 (t, J=6. 7Hz, 3H), 0. 96 (d, J=6. 1Hz, 3H), 0. 99 (d, J=6. 3Hz, 3H), 1. 14~1. 39 (m, 5H), 1. 45~1. 98 (m, 4H), 3. 27 (d, J=15Hz, 1H), 3. 37 (d, J=15Hz, 1H), 3. 71 (s, 2H), 3. 89 (s, 3H), 3. 95 (s, 3H), 3. 97 (s, 3H), 4. 62~4. 79 (m, 2H), 6. 21 (m, 1H), 6. 28 (m, 1H), 6. 53 (s, 1H), 7. 01 (d, J=7. 6Hz, 1H), 7. 35 (m, 1H), 7. 71 (s, 1H), 8. 18 (d, J=7. 4Hz, 1H)

【0499】実施例245 (s)-3-[(s)-2-(4-(1, 3-ジオキサラン-2-イル)ベンゾイ

ルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号725)の製造

融点 98~104℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3296, 1709, 1658, 1633

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 79 (t, J=6. 7Hz, 3H), 0. 97 (d, J=5. 4Hz, 6H), 1. 10~1. 38 (m, 4H), 1. 43~2. 15 (m, 5H), 3. 27 (d, J=15Hz, 1H), 3. 36 (d, J=15Hz, 1H), 3. 73 (s, 2H), 3. 98~4. 17 (m, 4H), 5. 62~4. 84 (m, 2H), 5. 85 (s, 1H), 6. 21 (m, 1H), 6. 29 (m, 1H), 6. 75 (d, J=8. 2Hz, 1H), 6. 88 (d, J=7. 6Hz, 1H), 7. 36 (m, 1H), 7. 53 (d, J=8. 3Hz, 2H), 7. 79 (d, J=8. 3Hz, 2H)

【0500】実施例246 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-2-(2-メトキシカルボニル)ベンゾイルアミノ-4-メチルパレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号727)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3356, 3288, 1717, 1660, 1647

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 87 (t, J=7. 0Hz, 3H), 0. 94 (d, J=6. 0Hz, 6H), 1. 12~1. 38 (m, 4H), 1. 43~1. 78 (m, 4H), 1. 83 (m, 1H), 3. 37 (d, J=15Hz, 1H), 3. 42 (d, J=15Hz, 1H), 3. 72 (s, 2H), 3. 83 (s, 3H), 4. 60~4. 82 (m, 2H), 6. 09 (d, J=7. 5Hz, 1H), 6. 23 (d, J=2. 3Hz, 1H), 6. 28 (m, 1H), 6. 36 (m, 1H), 7. 39~7. 75 (m, 4H), 7. 96 (m, 1H)

【0501】実施例247 (s)-3-[(s)-2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ]-1-(3-フルメチルチオ)-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号729)の製造

融点 56~57℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3339, 1705, 1680, 1663

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 88 (t, J=6. 8Hz, 3H), 0. 93~0. 96 (m, 6H), 1. 07~1. 46 (m, 5H), 1. 44 (s, 9H), 1. 47~1. 75 (m, 3H), 1. 75~1. 97 (m, 1H), 3. 17 (d, J=15Hz, 1H), 3. 27 (d, J=15Hz, 1H), 3. 53 (s, 2H), 4. 10 (m, 1H), 4. 78 (m, 1H), 4. 88 (d, J=7. 9Hz, 1H), 6. 3

8 (m, 1H), 6.72 (d, J=7.7Hz, 1H), 7.34~7.42 (m, 2H)

【0502】実施例248 (s)-3-(s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(3-フリルメチルチオ)-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号732)の製造

融点 67~68℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3302, 1732, 1691, 1653

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, J=7.1Hz, 3H), 0.94 (d, J=5.9Hz, 6H), 1.14~1.41 (m, 4H), 1.43~1.78 (m, 4H), 1.84 (m, 1H), 3.16 (d, J=15Hz, 1H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.52 (s, 2H), 4.21 (m, 1H), 4.79 (m, 1H), 5.11 (s, 2H), 5.14 (d, J=7.4Hz, 1H), 6.38 (m, 1H), 6.57 (d, J=7.7Hz, 1H), 7.35~7.42 (m, 7H)

【0503】実施例249 (s)-1-(3-フリルメチルチオ)-3-[(s)-2-(2-メトキシベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号736)の製造

融点 81~82℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3316, 1717, 1685, 1641, 1608

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, J=7.0Hz, 3H), 0.94 (d, J=6.1Hz, 6H), 1.10~1.40 (m, 4H), 1.41~1.79 (m, 4H), 1.83 (m, 1H), 3.16 (d, J=15Hz, 1H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.52 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 4.19 (m, 1H), 4.75 (m, 1H), 5.11 (d, J=7.1Hz, 1H), 5.18 (s, 2H), 6.38 (m, 1H), 6.58 (d, J=7.7Hz, 1H), 6.92~6.99 (m, 2H), 7.27~7.38 (m, 2H), 7.38~7.42 (m, 2H)

【0504】実施例250 (s)-1-(3-フリルメチルチオ)-3-[(s)-2-(3-メトキシベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号737)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3306, 1709, 1657

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, J=6.9Hz, 2H), 0.94 (d, J=6.0Hz, 6H), 1.11~1.39 (m, 4H), 1.42~1.79 (m, 4H), 1.83 (m, 1H), 3.1

7 (d, J=15Hz, 1H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.49 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 4.21 (m, 1H), 4.77 (m, 1H), 5.08 (s, 2H), 5.25 (d, J=8.1Hz, 1H), 6.37 (m, 1H), 6.63 (d, J=7.6Hz, 1H), 6.81~6.98 (m, 3H), 7.21~7.37 (m, 1H), 7.36~7.42 (m, 2H)

【0505】実施例251 (s)-1-(3-フリルメチルチオ)-3-[(s)-2-(4-メトキシベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号738)の製造

融点 70~71℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3298, 1701, 1682, 1649, 1614

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, J=8.9Hz, 3H), 0.93 (d, J=5.0Hz, 6H), 1.07~1.39 (m, 4H), 1.41~1.78 (m, 4H), 1.87 (m, 1H), 3.16 (d, J=15Hz, 1H), 3.27 (d, J=15Hz, 1H), 3.52 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 4.18 (m, 1H), 4.76 (m, 1H), 5.04 (s, 2H), 5.10 (d, J=7.9Hz, 1H), 6.37 (m, 1H), 6.57 (d, J=7.5Hz, 1H), 6.87 (d, J=8.6Hz, 2H), 7.28 (d, J=8.6Hz, 2H), 7.35~7.39 (m, 2H)

【0506】実施例252 (s)-1-(3-フリルメチルチオ)-3-[(s)-2-(4-メトキシフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号742)の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3295, 1715, 1653

NMR (CDCl_3 , δ): 0.86 (t, J=7.0Hz, 3H), 0.92~1.01 (m, 6H), 1.17~1.38 (m, 5H), 1.45~1.79 (m, 3H), 1.82 (m, 1H), 3.17 (d, J=15Hz, 1H), 3.26 (d, J=15Hz, 1H), 3.54 (s, 2H), 3.77 (s, 3H), 4.50 (s, 2H), 4.58 (m, 1H), 4.78 (m, 1H), 6.38 (d, J=1.2Hz, 1H), 6.65 (d, J=7.7Hz, 1H), 6.81~6.94 (m, 4H), 6.94 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.36~7.39 (m, 2H)

【0507】実施例253 (s)-3-[(s)-2-(2,6-ジメチルフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-(3-フリルメチルチオ)-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号745)の製造

融点 92℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3304, 1730, 1651

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.87 (t, $J=6.9$ Hz, 3H), 0.97~1.04 (m, 6H), 1.17~1.41 (m, 4H), 1.49~2.01 (m, 5H), 2.26 (s, 6H), 3.19 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.29 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.54 (s, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.60 (m, 1H), 4.80 (m, 1H), 6.38 (m, 1H), 6.69 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 6.91~7.04 (m, 3H), 7.28 (d, $J=7.2$ Hz, 1H), 7.35~7.39 (m, 2H)

【0508】実施例254 (s)-1-(3-フリルメチルチオ)-3-[(s)-2-(4-メトキシシナモイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号749) の製造

IR (neat, cm^{-1}) : 3269, 1711, 1649, 1602

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.83 (t, $J=6.6$ Hz, 3H), 0.96 (d, $J=4.3$ Hz, 6H), 1.07~1.42 (m, 5H), 1.44~1.98 (m, 4H), 3.17 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.26 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.52 (s, 2H), 3.82 (s, 3H), 4.62~4.81 (m, 2H), 6.31 (d, $J=16$ Hz, 1H), 6.38 (m, 1H), 6.85 (dd, $J=8.8$ Hz, 1.7 Hz, 2H), 6.97 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.04 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.32~7.39 (m, 2H), 7.42 (dd, $J=8.8$ Hz, 1.7 Hz, 2H), 7.59 (d, $J=16$ Hz, 1H)

【0509】実施例255 (s)-1-(3-フリルメチルチオ)-3-[(s)-4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルベンゾイルアミノ)バレリルアミノ]-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号755) の製造

融点 140~141℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3302, 1730, 1660, 1630

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.83 (t, $J=6.7$ Hz, 3H), 0.99 (d, $J=5.8$ Hz, 6H), 1.17~1.38 (m, 4H), 1.48~1.98 (m, 5H), 3.20 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.28 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.55 (s, 2H), 4.72 (m, 1H), 4.80 (m, 1H), 6.39 (m, 1H), 6.67 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 6.85 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 7.35~7.41 (m, 2H), 7.6

9 (d, $J=8.3$ Hz, 2H), 7.89 (d, $J=8.3$ Hz, 2H)

【0510】実施例256 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(2-メチル-3-フリルメチルチオ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号756) の製造

IR (neat, cm^{-1}) : 3304, 1711, 1659, 1532

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.87 (t, $J=6.5$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J=5.7$ Hz, 6H), 1.13~1.40 (m, 4H), 1.40~1.73 (m, 4H), 1.87 (m, 1H), 2.24 (s, 3H), 3.17 (d, $J=15.4$ Hz, 1H), 3.26 (d, $J=14.6$ Hz, 1H), 3.48 (s, 2H), 4.19 (m, 1H), 4.80 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 5.12 (br, 1H), 6.30 (br. s, 1H), 6.54 (br. d, $J=7.8$ Hz, 1H), 7.23 (br. s, 1H), 7.35 (br. s, 5H)

【0511】実施例257 (s)-3-((s)-2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(3-チエニルメトキシ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号817) の製造

融点 77~83℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3335, 1734, 1680, 1661

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.86 (t, $J=6.8$ Hz, 3H), 0.93 (d, $J=5.7$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J=5.9$ Hz, 3H), 1.15~1.75 (m, 8H), 1.45 (s, 9H), 1.83 (m, 1H), 4.10 (m, 1H), 4.14 (d, $J=17$ Hz, 1H), 4.21 (d, $J=17$ Hz, 1H), 4.58 (d, $J=12$ Hz, 1H), 4.64 (d, $J=12$ Hz, 1H), 4.75~4.93 (m, 2H), 6.65 (d, $J=7.8$ Hz, 1H), 7.10 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.27 (m, 1H), 7.32 (dd, $J=5.0$ Hz, 2.9 Hz, 1H)

【0512】実施例258 (s)-3-((s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノバレリルアミノ)-1-(3-チエニルメトキシ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号821) の製造

融点 76~78℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3310, 3235, 1726, 1649, 1599

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.85 (t, $J=6.9$ Hz, 3H), 0.92 (d, $J=5.8$ Hz, 6H), 1.09~1.39 (m, 4H), 1.42~1.98 (m, 5H), 4.13 (d, $J=17$ Hz, 1H), 4.22 (d, $J=17$ Hz, 1H), 4.5

2 (s, 2H), 4.55 (m, 1H), 4.58 (d, $J=12$ Hz, 1H), 4.64 (d, $J=12$ Hz, 1H), 4.79 (m, 1H), 6.56 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 6.93 (d, $J=7.9$ Hz, 2H), 6.94 (m, 1H), 6.99 (dd, $J=7.4$ Hz, 7.4 Hz, 1H), 7.10 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 7.22~7.41 (m, 4H)

【0513】実施例259 (s)-3-[(s)-2-(2,4-ジメトキシシンナモイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-(3-チエニルメトキシ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号825) の製造
融点 128~134℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3300, 1721, 1640, 1599

NMR (CDCl_3 , δ): 0.83 (t, $J=6.9$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J=5.9$ Hz, 6H), 1.13~1.38 (m, 4H), 1.42~1.95 (m, 5H), 3.83 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 4.14 (d, $J=17$ Hz, 1H), 4.24 (d, $J=17$ Hz, 1H), 4.58 (d, $J=12$ Hz, 1H), 4.61 (m, 1H), 4.64 (d, $J=12$ Hz, 1H), 4.72 (m, 1H), 5.95 (d, $J=8.2$ Hz, 1H), 6.40~6.55 (m, 3H), 6.74 (d, $J=7.2$ Hz, 1H), 7.10 (dd, $J=4.9$ Hz, 1.2 Hz, 1H), 7.20~7.35 (m, 2H), 7.38 (d, $J=8.4$ Hz, 1H), 7.78 (d, $J=16$ Hz, 1H)

【0514】実施例260 (s)-3-((s)-2-シクロヘキシルオキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号761) の製造
IR (neat, cm^{-1}): 3306, 1710, 1659, 1532

NMR (CDCl_3 , δ): 0.88 (t, $J=6.7$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J=5.9$ Hz, 3H), 0.96 (d, $J=5.8$ Hz, 3H), 1.12~1.80 (m, 16H), 1.80~1.96 (m, 3H), 3.15 (d, $J=14.7$ Hz, 1H), 3.25 (d, $J=14.6$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.17 (m, 1H), 4.63 (m, 1H), 4.77 (m, 1H), 4.96 (m, 1H), 6.61 (br. d, $J=6.5$ Hz, 1H), 7.05 (dd, $J=6.0$ Hz, 1.0 Hz, 1H), 7.16 (d, $J=1.8$ Hz, 1H), 7.28 (dd, $J=4.9$ Hz, 2.9 Hz, 1H)

【0515】実施例261 (s)-3-((s)-2-シクロヘキシルメトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(3-チエニルメチルチオ)-

2-ヘプタノン (表-1の化合物番号762) の製造
IR (neat, cm^{-1}): 3308, 1713, 1659

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85~1.08 (m, 8H), 0.88 (t, $J=6.4$ Hz, 3H), 1.12~1.40 (m, 8H), 1.40~1.98 (m, 10H), 3.15 (d, $J=14.6$ Hz, 1H), 3.25 (d, $J=14.2$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 3.88 (d, $J=5.9$ Hz, 2H), 4.16 (br., 1H), 4.77 (m, 1H), 5.02 (br. d, $J=6.5$ Hz, 1H), 6.59 (br. d, $J=8.1$ Hz, 1H), 7.05 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.28 (m, 1H)

【0516】実施例262 (s)-3-((s)-2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号759) の製造
融点 74.5~75.5℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3343, 1703, 1682, 1661, 1523

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, $J=6.7$ Hz, 3H), 0.94 (d, $J=5.9$ Hz, 6H), 1.12~1.75 (m, 8H), 1.45 (s, 9H), 1.98 (m, 1H), 3.15 (d, $J=14.7$ Hz, 1H), 3.24 (d, $J=14.7$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.11 (m, 1H), 4.77 (m, 1H), 4.83 (m, 1H), 6.66 (br. d, $J=7.7$ Hz, 1H), 7.05 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 7.16 (d, $J=2.9$ Hz, 1H), 7.28 (dd, $J=4.9$ Hz, 3.0 Hz, 1H)

【0517】実施例263 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号763) の製造
融点 65~67℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3306, 1730, 1690, 1653, 1534

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (t, $J=6.8$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J=6.1$ Hz, 6H), 1.12~1.39 (m, 4H), 1.44~1.73 (m, 4H), 1.85 (m, 1H), 3.14 (d, $J=14.4$ Hz, 1H), 3.25 (d, $J=14.7$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.20 (m, 1H), 4.77 (ddd, $J=7.8$ Hz, 7.8 Hz, 4.4 Hz, 1H), 5.12 (s, 2H), 5.13 (br. s, 1H), 6.54 (br. d, $J=7.7$ Hz, 1H), 7.05 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.16 (br. s, 1H),

7. 29 (dd, J=5. 0Hz, 3. 1Hz, 1H), 7. 35 (br. s, 5H)

【0518】実施例264 (s)-3-[(s)-2-(2-フルオロベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号764) の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3306, 1711, 1657

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 87 (t, J=6. 8Hz, 3H), 0. 94 (d, J=5. 9Hz, 6H), 1. 10~1. 40 (m, 4H), 1. 41~1. 79 (m, 4H), 1. 85 (m, 1H), 3. 14 (d, J=14. 7Hz, 1H), 3. 25 (d, J=14. 6Hz, 1H), 3. 70 (s, 2H), 4. 20 (m, 1H), 4. 76 (ddd, J=7. 9Hz, 7. 9Hz, 4. 7Hz, 1H), 5. 19 (s, 2H), 5. 19 (br., 1H), 6. 57 (br. d, J=7. 6Hz, 1H), 7. 03~7. 06 (m, 2H), 7. 11 (dd, J=7. 5Hz, 0. 8Hz, 1H), 7. 16 (br. s, 1H), 7. 27 (dd, J=5. 3Hz, 2. 1Hz, 1H), 7. 30~7. 41 (m, 2H)

【0519】実施例265 (s)-3-[(s)-2-(4-フルオロベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号766) の製造

融点 89~90℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3316, 1690, 1651, 1528

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 87 (t, J=6. 8Hz, 3H), 0. 95 (d, J=6. 1Hz, 6H), 1. 10~1. 20 (m, 4H), 1. 44~1. 75 (m, 4H), 1. 85 (m, 1H), 3. 15 (d, J=14. 6Hz, 1H), 3. 25 (d, J=14. 5Hz, 1H), 3. 71 (s, 2H), 4. 19 (m, 1H), 4. 77 (ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 4. 6Hz, 1H), 5. 07 (s, 2H), 5. 14 (br. d, J=7. 5Hz, 1H), 6. 53 (br. d, J=7. 7Hz, 1H), 7. 00~7. 07 (m, 3H), 7. 15 (d, J=1. 8Hz, 1H), 7. 27 (dd, J=5. 3Hz, 3. 1Hz, 1H), 7. 29~7. 36 (m, 2H)

【0520】実施例266 (s)-3-[(s)-4-メチル-2-(1-ナフチルメトキシカルボニルアミノ)パレリルアミノ]-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号770) の製造

融点 82~85℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3304, 1688, 1655, 1532

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 86 (t, J=6. 8Hz, 3H), 0. 94 (br. s, 6H), 1. 10~1. 38 (m, 4H), 1. 42~1. 73 (m, 4H), 1. 85 (m, 1H), 3. 15 (d, J=14. 9Hz, 1H), 3. 26 (d, J=14. 1Hz, 1H), 3. 71 (s, 2H), 4. 22 (m, 1H), 4. 76 (m, 1H), 5. 13 (br. d, J=8. 5Hz, 1H), 5. 59 (s, 2H), 6. 58 (br. d, J=7. 6Hz, 1H), 7. 05 (d, J=4. 8Hz, 1H), 7. 16 (br. s, 1H), 7. 28 (dd, J=5. 0Hz, 3. 0Hz, 1H), 7. 44 (dd, J=8. 0Hz, 8. 0Hz, 1H), 7. 47~7. 59 (m, 3H), 7. 83 (dd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 2H), 8. 03 (d, J=7. 6Hz, 1H)

【0521】実施例267 (s)-3-[(s)-4-メチル-2-(2-ピリジルメトキシカルボニルアミノ)パレリルアミノ]-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号772) の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3308, 1713, 1659, 1534

NMR (CDCl_3 , δ): 0. 86 (t, J=6. 8Hz, 3H), 0. 95 (d, J=6. 1Hz, 3H), 0. 96 (d, J=6. 1Hz, 3H), 1. 15~1. 35 (m, 4H), 1. 45~1. 77 (m, 4H), 1. 85 (m, 1H), 3. 15 (d, J=14. 6Hz, 1H), 3. 24 (d, J=14. 6Hz, 1H), 3. 70 (s, 2H), 4. 21 (ddd, J=9. 1Hz, 9. 1Hz, 5. 3Hz, 1H), 4. 77 (ddd, J=8. 0Hz, 8. 0Hz, 4. 8Hz, 1H), 5. 24 (d, J=2. 3Hz, 2H), 5. 31 (br. d, J=5. 9Hz, 1H), 6. 59 (br. d, J=7. 3Hz, 1H), 7. 04 (dd, J=5. 0Hz, 1. 2Hz, 1H), 7. 15 (br. s, 1H), 7. 23 (dd, J=7. 6Hz, 5. 1Hz, 1H), 7. 28 (dd, J=5. 0Hz, 3. 0Hz, 1H), 7. 34 (d, J=7. 8Hz, 1H), 7. 70 (ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 1. 8Hz, 1H), 8. 59 (d, J=5. 6Hz, 1H)

【0522】実施例268 (s)-3-[(s)-4-メチル-2-(N-オキシ-2-ピリジルメトキシカルボニルアミノ)パレリルアミノ]-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号773) の製造

IR (neat, cm^{-1}): 3285, 1726, 16

61, 1537

NMR (CDCl₃, δ) : 0.85 (t, J=6.8 Hz, 3H), 0.96 (d, J=6.0 Hz, 3H), 0.97 (d, J=6.2 Hz, 3H), 1.14~1.37 (m, 4H), 1.47~1.77 (m, 4H), 1.85 (m, 1H), 3.16 (d, J=14.8 Hz, 1H), 3.25 (d, J=14.8 Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.22 (m, 1H), 4.78 (ddd, J=7.8 Hz, 7.8 Hz, 4.6 Hz, 1H), 5.39 (d, J=6.9 Hz, 2H), 5.45 (d, J=8.0 Hz, 1H), 6.57 (d, J=7.5 Hz, 1H), 7.05 (dd, J=4.9 Hz, 1.2 Hz, 1H), 7.16 (br. s, 1H), 7.22~7.37 (m, 3H), 7.40 (dd, J=7.4 Hz, 1.9 Hz, 1H), 8.25 (d, J=5.8 Hz, 1H)

【0523】実施例269 (s)-3-[(s)-4-メチル-2-(3-ピリジルメトキシカルボニルアミノ)パレリルアミノ]-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号774) の製造

IR (neat, cm⁻¹) : 3304, 1713, 1661, 1537

NMR (CDCl₃, δ) : 0.86 (t, J=6.7 Hz, 3H), 0.95 (d, J=5.7 Hz, 6H), 1.13~1.40 (m, 4H), 1.40~1.72 (m, 4H), 1.85 (m, 1H), 3.15 (d, J=14.5 Hz, 1H), 3.25 (d, J=14.8 Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.20 (m, 1H), 4.78 (ddd, J=7.9 Hz, 7.9 Hz, 4.6 Hz, 1H), 5.24 (d, J=2.4 Hz, 2H), 5.28 (br. d, J=7.9 Hz, 1H), 6.55 (br. d, J=7.0 Hz, 1H), 7.05 (dd, J=4.9 Hz, 1.1 Hz, 1H), 7.16 (d, J=1.7 Hz, 1H), 7.29 (dd, J=4.8 Hz, 1.9 Hz, 1H), 7.30 (dd, J=7.7 Hz, 4.8 Hz, 1H), 7.70 (d, J=7.7 Hz, 1H), 8.57 (dd, J=4.8 Hz, 1.5 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H)

【0524】実施例270 (s)-3-[(s)-4-メチル-2-(3,4-メチレンジオキシベンジロキシカルボニルアミノ)パレリルアミノ]-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号779) の製造

融点 78~80℃

IR (KBr, cm⁻¹) : 3299, 1703, 1684, 1649, 1526

NMR (CDCl₃, δ) : 0.87 (t, J=6.8 Hz, 3H), 0.94 (d, J=6.0 Hz, 6

H), 1.12~1.38 (m, 4H), 1.43~1.74 (m, 4H), 1.86 (m, 1H), 3.14 (d, J=14.6 Hz, 1H), 3.25 (d, J=14.8 Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.18 (m, 1H), 4.76 (ddd, J=7.8 Hz, 7.8 Hz, 2.3 Hz, 1H), 5.01 (s, 2H), 5.11 (br. d, J=8.0 Hz, 1H), 5.96 (s, 2H), 6.55 (br. d, J=7.7 Hz, 1H), 6.79 (m, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.05 (dd, J=5.0 Hz, 1.1 Hz, 1H), 7.16 (br. s, 1H), 7.29 (dd, J=5.0 Hz, 3.0 Hz, 1H)

【0525】実施例271 (s)-3-[(s)-2-(2,2-ジメチル-2,3-ジヒドロ-7-ベンゾフラニルメトキシカルボニルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号781) の製造

IR (neat, cm⁻¹) : 3304, 1719, 1659, 1532

NMR (CDCl₃, δ) : 0.86 (t, J=6.8 Hz, 3H), 0.94 (d, J=6.0 Hz, 6H), 1.16~1.36 (m, 4H), 1.47 (s, 6H), 1.47~1.72 (m, 4H), 1.85 (m, 1H), 3.01 (s, 2H), 3.14 (d, J=14.4 Hz, 1H), 3.25 (d, J=14.4 Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 4.20 (m, 1H), 4.75 (ddd, J=7.9 Hz, 7.9 Hz, 4.7 Hz, 1H), 5.10 (d, J=3.1 Hz, 2H), 5.10 (br., 1H), 6.62 (br. d, J=7.2 Hz, 1H), 6.79 (dd, J=7.4 Hz, 7.4 Hz, 1H), 7.05 (dd, J=4.9 Hz, 1.2 Hz, 1H), 7.05~7.18 (m, 3H), 7.28 (dd, J=5.0 Hz, 3.0 Hz, 1H)

【0526】実施例272 (s)-3-((s)-2-アミノ-4-メチルパレリルアミノ)-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ヘプタノン塩酸塩 (表-1の化合物番号783) の製造

融点 121~123℃

IR (KBr, cm⁻¹) : 3385, 1699, 1669, 1522

NMR (CDCl₃, δ) : 0.93 (br. t, J=6.7 Hz, 3H), 1.01 (d, J=5.5 Hz, 3H), 1.03 (d, J=5.6 Hz, 3H), 1.26~1.44 (m, 4H), 1.44~1.90 (m, 5H), 3.26 (d, J=15.2 Hz, 1H), 3.36 (d, J=15.2 Hz, 1H), 3.75 (s, 2H), 3.91 (m, 1H), 4.73 (m, 1H), 7.07 (dd, J=5.1 Hz, 1.3 Hz, 1H), 7.23 (br. s, 1H), 7.3

6 (dd, J=5.0 Hz, 3.0 Hz, 1H)

【0527】実施例273 (s)-3-((s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノパレリルアミノ)-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号786)の製造

融点 78~79℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3314, 1705, 1649, 1534

NMR (CDCl_3 , δ): 0.86 (t, J=6.8 Hz, 3H), 0.92 (d, J=6.2 Hz, 3H), 0.94 (d, J=6.2 Hz, 3H), 1.10~1.40 (m, 4H), 1.44~1.75 (m, 4H), 1.84 (m, 1H), 3.16 (d, J=14.7 Hz, 1H), 3.25 (d, J=14.7 Hz, 1H), 3.72 (s, 2H), 4.53 (s, 2H), 4.55 (m, 1H), 4.76 (dddd, J=7.9 Hz, 7.9 Hz, 4.5 Hz, 1H), 6.59 (d, J=8.0 Hz, 1H), 6.94 (d, J=8.7 Hz, 2H), 6.95 (br., 1H), 7.00~7.07 (m, 2H), 7.17 (d, J=1.1 Hz, 1H), 7.29 (dd, J=4.9 Hz, 2.7 Hz, 1H), 7.35 (d, J=7.5 Hz, 1H)

【0528】実施例274 (s)-3-[(s)-4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルベンゾイルアミノ)パレリルアミノ]-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ヘプタノン(表-1の化合物番号792)の製造

融点 131~133℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3293, 1730, 1657, 1638, 1539

NMR (CDCl_3 , δ): 0.82 (t, J=6.8 Hz, 3H), 0.99 (d, J=5.8 Hz, 6H), 1.08~1.38 (m, 4H), 1.42~1.91 (m, 5H), 3.17 (d, J=14.7 Hz, 1H), 3.26 (d, J=14.7 Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.64~4.93 (m, 2H), 6.66 (br. d, J=7.7 Hz, 1H), 6.85 (br. d, J=7.7 Hz, 1H), 7.06 (d, J=5.0 Hz, 1H), 7.18 (br. s, 1H), 7.28 (dd, J=4.9 Hz, 2.0 Hz, 1H), 7.69 (d, J=8.2 Hz, 2H), 7.90 (d, J=8.0 Hz, 2H)

【0529】実施例275 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-2-(2-メトキシベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号793)の製造

融点 102~103℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3360, 3297, 1728, 1661, 1626, 1601

NMR (CDCl_3 , δ): 0.92 (d, J=6.4 Hz, 3H), 0.94 (d, J=6.6 Hz, 3H), 1.45~1.85 (m, 3H), 2.93 (d, J=14 Hz, 7.8 Hz, 1H), 3.13 (d, J=14 Hz, 7.8 Hz, 1H), 3.17 (d, J=15 Hz, 1H), 3.25 (d, J=15 Hz, 1H), 3.64 (s, 2H), 3.92 (s, 3H), 4.62 (m, 1H), 4.96 (m, 1H), 6.19 (d, J=3.1 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.99 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.05~7.18 (m, 7H), 7.34 (m, 1H), 7.49 (td, J=7.4 Hz, 1.2 Hz, 1H), 8.01 (d, J=7.2 Hz, 1H), 8.16 (dd, J=7.8 Hz, 1.2 Hz, 1H)

【0530】実施例276 (s)-1-フルフリルチオ-3-[(s)-4-メチル-2-(4-トリフルオロメチルベンゾイルアミノ)パレリルアミノ]-4-フェニル-2-ブタノン(表-1の化合物番号797)の製造

融点 169℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3297, 1723, 1640

NMR (CDCl_3 , δ): 0.95 (d, J=5.3 Hz, 6H), 1.50~1.75 (m, 3H), 2.97 (dd, J=14 Hz, 7.6 Hz, 1H), 3.14 (dd, J=14 Hz, 7.6 Hz, 1H), 3.19 (s, 2H), 3.66 (s, 2H), 4.62 (m, 1H), 5.03 (m, 1H), 6.19 (d, J=3.2 Hz, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.57 (d, J=8.5 Hz, 1H), 6.68 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.08~7.29 (m, 5H), 7.35 (m, 1H), 7.70 (d, J=8.2 Hz, 2H), 7.85 (d, J=8.2 Hz, 2H)

【0531】実施例277 (s)-3-((s)-2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-4-フェニル-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ブタノン(表-1の化合物番号798)の製造

融点 95~99℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3349, 1709, 1667, 1603

NMR (CDCl_3 , δ): 0.90 (d, J=6.0 Hz, 3H), 0.91 (d, J=6.2 Hz, 3H), 1.28~1.50 (m, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.50~1.77 (m, 2H), 2.95~3.20 (m, 4H), 3.61 (s, 2H), 4.05 (m, 1H), 4.75 (m, 1H), 5.01 (m, 1H), 6.66 (d, J=7.8 Hz, 1

H), 7.02 (m, 1H), 7.07~7.19 (m, 3H), 7.22~7.38 (m, 4H)

【0532】実施例278 (s)-3-((s)-2-シクロヘキシルメトキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-4-フェニル-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ブタノン(表-1の化合物番号800)の製造

融点 81~83℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3308, 1707, 1668, 1667

NMR (CDCl_3 , δ): 0.85~1.05 (m, 8H), 1.12~1.50 (m, 4H), 1.50~1.82 (m, 8H), 2.91~3.18 (m, 4H), 3.62 (s, 2H), 3.86 (d, $J=6.2\text{Hz}$, 2H), 4.08 (m, 1H), 4.89 (m, 1H), 5.01 (m, 1H), 6.62 (d, $J=7.9\text{Hz}$, 1H), 7.01 (dd, $J=5.0\text{Hz}$, 1.3Hz, 1H), 7.06~7.18 (m, 3H), 7.18~7.37 (m, 4H)

【0533】実施例279 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルパレリルアミノ)-4-フェニル-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ブタノン(表-1の化合物番号801)の製造

融点 104~105℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3324, 3291, 1725, 1690, 1651

NMR (CDCl_3 , δ): 0.90 (d, $J=6.1\text{Hz}$, 6H), 1.31~1.70 (m, 3H), 2.90~3.18 (m, 4H), 3.61 (s, 2H), 4.12 (m, 1H), 4.92~5.05 (m, 2H), 5.09 (s, 2H), 6.59 (d, $J=8.1\text{Hz}$, 1H), 7.01 (dd, $J=5.0\text{Hz}$, 1.3Hz, 1H), 7.05~7.40 (m, 12H)

【0534】実施例280 (s)-3-((s)-2-アミノ-4-メチルパレリルアミノ)-4-フェニル-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ブタノン塩酸塩(表-1の化合物番号803)の製造

IR (KBr, cm^{-1}): 3383, 1696, 1672, 1605

NMR (CDCl_3 , δ): 0.97 (d, $J=5.9\text{Hz}$, 3H), 0.99 (d, $J=5.6\text{Hz}$, 3H), 1.63~1.70 (m, 3H), 2.91 (dd, $J=14\text{Hz}$, 9.0Hz, 1H), 3.17 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.18 (dd, $J=14\text{Hz}$, 9.0Hz, 1H), 3.26 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.67 (s, 2H), 3.82 (t, $J=7.3\text{Hz}$, 1H), 4.99 (dd, $J=9.0\text{Hz}$, 5.8Hz, 1H), 7.03 (dd, $J=5.$

0Hz, 1.3Hz, 1H), 7.15~7.38 (m, 7H)

【0535】実施例281 (s)-3-((s)-4-メチル-2-フェノキシアセチルアミノパレリルアミノ)-4-フェニル-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ブタノン(表-1の化合物番号804)の製造

融点 89~91℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3443, 3291, 1730, 1651, 1601

NMR (CDCl_3 , δ): 0.87 (d, $J=6.2\text{Hz}$, 1H), 0.89 (d, $J=6.2\text{Hz}$, 1H), 1.42~1.74 (m, 3H), 2.93 (dd, $J=14\text{Hz}$, 8.4Hz, 1H), 3.05 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.12 (dd, $J=14\text{Hz}$, 8.4Hz, 1H), 3.13 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.64 (s, 2H), 4.39 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 4.45 (m, 1H), 4.48 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 5.01 (td, $J=7.6\text{Hz}$, 6.5Hz, 1H), 6.65 (d, $J=7.6\text{Hz}$, 1H), 6.75 (d, $J=8.3\text{Hz}$, 1H), 6.91 (dd, $J=8.8\text{Hz}$, 1.1Hz, 2H), 7.00~7.39 (m, 11H)

【0536】実施例282 (s)-3-[(s)-2-(4-メトキシフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-4-フェニル-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ブタノン(表-1の化合物番号808)の製造

融点 93~96℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3279, 1709, 1676, 1647

NMR (CDCl_3 , δ): 0.88 (d, $J=6.1\text{Hz}$, 3H), 0.89 (d, $J=6.1\text{Hz}$, 3H), 1.42~1.78 (m, 3H), 2.93 (dd, $J=14\text{Hz}$, 7.6Hz, 1H), 3.05 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.12 (dd, $J=14\text{Hz}$, 7.6Hz, 1H), 3.13 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 3.64 (s, 2H), 3.78 (s, 3H), 4.33 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 4.43 (d, $J=15\text{Hz}$, 1H), 4.46 (m, 1H), 5.0 (td, $J=7.6\text{Hz}$, 6.5Hz, 1H), 6.64 (d, $J=7.7\text{Hz}$, 1H), 6.75 (d, $J=8.2\text{Hz}$, 1H), 7.01 (s, 4H), 7.02 (dd, $J=5.0\text{Hz}$, 1.3Hz, 1H), 7.07~7.32 (m, 7H)

【0537】実施例283 (s)-3-[(s)-2-(2-メトキシベンゾイルアミノ)-4-メチルパレリルアミノ]-4-フェニル-1-(3-チエニルメチルチオ)-2-ブタノン(表-1の化合物番号813)の製造

融点 115~117℃

IR (KBr, cm^{-1}) : 3374, 3343, 1734, 1665, 1628, 1601

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.92 (d, $J=6.5$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J=6.6$ Hz, 3H), 1.47~1.82 (m, 3H), 2.92 (d, $J=14$ Hz, 7.9 Hz, 1H), 3.04~3.20 (m, 3H), 3.63 (s, 2H), 3.93 (s, 3H), 4.63 (m, 1H), 4.96 (m, 1H), 6.96~7.18 (m, 10H), 7.26 (m, 1H), 7.49 (m, 1H), 8.02 (d, $J=7.3$ Hz, 1H), 8.17 (dd, $J=7.8$ Hz, 1.9 Hz, 1H)

【0538】実施例284 (s)-3-[(s)-2-(4-ホルミルベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号726)の製造

融点 50℃ (分解)

IR (KBr, cm^{-1}) : 3290, 1707, 1637

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.80 (t, $J=6.8$ Hz, 3H), 0.98 (d, $J=5.8$ Hz, 6H), 1.17~1.39 (m, 4H), 1.45~1.62 (m, 1H), 1.63~1.98 (m, 4H), 3.26 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.37 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.73 (s, 2H), 4.65~4.83 (m, 2H), 6.22 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 6.86 (d, $J=7.3$ Hz, 1H), 7.03 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.81~8.0 (m, 4H), 10.07 (s, 1H)

【0539】実施例285 (s)-3-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-1-(3-チエニルメトキシ)-2-ヘプタノン (表-1の化合物番号819)の製造

IR (KBr, cm^{-1}) : 3295, 1728, 1690, 1651

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.85 (t, $J=6.9$ Hz, 3H), 0.93 (d, $J=6.0$ Hz, 6H), 1.06~1.38 (m, 4H), 1.39~1.78 (m, 4H), 1.82 (m, 1H), 4.02~4.24 (m, 3H), 4.57 (d, $J=10$ Hz, 1H), 4.61 (d, $J=10$ Hz, 1H), 4.80 (m, 1H), 5.10 (s, 2H), 5.22 (d, $J=7.2$ Hz, 1H), 6.60 (d, $J=6.8$ Hz, 1H), 7.09 (dd, $J=4.0$ Hz, 0.9 Hz, 1H), 7.24 (m, 1H), 7.29~7.42 (m, 6H)

【0540】実施例286 (s)-3-[(s)-2-((s)-2-シクロヘキシルメトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-4-メチルバレリ

ルアミノ]-1-フルフリルチオ-2-ヘプタノン (表-2の化合物番号842)の製造

IR (neat, cm^{-1}) : 3300, 1700, 1670, 1640

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.85~1.70 (m, 15H), 1.15~2.0 (m, 23H), 3.26 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.32 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.71 (s, 2H), 3.87 (d, $J=6.4$ Hz, 2H), 4.12 (m, 1H), 4.42 (m, 1H), 4.69 (m, 1H), 5.03 (d, $J=5.8$ Hz, 1H), 6.22 (d, $J=3.3$ Hz, 1H), 6.28 (dd, $J=3.3$ Hz, 2.1 Hz, 1H), 6.47 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 6.76 (m, 1H), 7.35 (d, $J=2.1$ Hz, 1H)

【0541】参考例3 (s)-1-((s)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリル)-2-フルフリルチオアセチルピロリジンの製造

IR (neat, cm^{-1}) : 3300, 1710, 1640

NMR (CDCl_3 , δ) : 0.93 (d, $J=5.9$ Hz, 3H), 0.98 (d, $J=6.5$ Hz, 3H), 1.48 (dd, $J=6.9$ Hz, 6.9 Hz, 2H), 1.64~1.80 (m, 2H), 1.84~2.28 (m, 3H), 3.30 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.42 (d, $J=15$ Hz, 1H), 3.59 (m, 1H), 3.70 (s, 2H), 3.82 (m, 1H), 4.57 (m, 1H), 4.74 (d, $J=7.9$ Hz, 5.9 Hz, 1H), 5.03~5.12 (m, 2H), 5.39 (d, $J=6.8$ Hz, 1H), 6.23 (m, 1H), 6.29 (m, 1H), 7.24~7.39 (m, 6H)

【0542】試験例1 チオールプロテアーゼ阻害活性の測定

パパイン (シグマ社, P-3125) 及びカテプシンB (シグマ社, C-6286) の阻害活性は、文献 (Biochemical Journal, 201巻, 189ページ, 1982年) 記載の方法に準じて測定した。カテプシンLはラット腎臓より文献 (Journal of Biochemistry, 100巻, 35ページ, 1986年) 記載の方法により精製し、その阻害活性は上述したカテプシンBと同様の方法で測定した。m-カルパインは、ラットの脳より文献 (Journal of Biological Chemistry, 259巻, 3210ページ, 1984年) 記載の方法により精製し、その阻害活性は、文献 (Journal of Biological Chemistry, 259巻, 12489ページ, 1984年) 記載の方法に準じて測定した。その結果を表-3及び表-4に示す。表-3及び表-4より、本発明の化合物は、パパイン、

カテプシンB、カテプシンL、m-カルパイン等のチオールプロテアーゼに対して、強い阻害性を示すことがわかる。

【0543】

【表179】

表-3 チオールプロテアーゼに対する阻害活性

実施例番号の化合物 (表-1の化合物番号)	IC ₅₀ (μM)			
	パパイニン	カテプシンB	カテプシンL	m-カルパイン
3 (No. 82)	0.26	0.71	0.016	3.3
4 (No. 83)	0.21	0.044	0.045	12
21 (No. 46)	0.13	0.14	—	4.7
22 (No. 48)	1.1	0.98	1.3	11
23 (No. 49)	22	3.7	1.1	6.4
28 (No. 59)	3.4	2.1	15	11
30 (No. 66)	0.15	0.59	—	5.1
31 (No. 69)	1.4	0.55	0.63	22
33 (No. 76)	0.70	1.2	0.27	6.4
34 (No. 79)	0.36	0.41	0.51	5.5
35 (No. 81)	0.21	0.70	1.1	8.6
36 (No. 85)	26	4.9	1.3	25
37 (No. 86)	1.3	0.70	0.45	15
38 (No. 87)	0.42	0.62	0.72	5.0
39 (No. 88)	0.25	0.29	—	2.2
40 (No. 90)	2.1	0.27	0.85	8.4
41 (No. 91)	21	5.7	1.1	14
42 (No. 92)	4.5	1.9	0.74	23
43 (No. 94)	0.37	0.057	0.038	5.8
44 (No. 96)	0.88	0.17	0.060	22
45 (No. 97)	0.51	0.38	0.19	11
46 (No. 100)	0.39	0.40	0.10	16
49 (No. 107)	0.040	0.59	0.67	11
52 (No. 114)	0.34	0.82	—	2.5
53 (No. 115)	9.2	11	1.5	6.2
54 (No. 116)	0.38	0.88	0.25	14
82 (No. 162)	34	2.7	0.32	20
83 (No. 161)	47	5.0	0.40	12

【0544】

【表180】

表-3 チオールプロテアーゼに対する阻害活性 (つづき)

実施例番号の化合物 (表-1の化合物番号)	I C ₅₀ (μM)			
	パ パ イ ン	カテプシンB	カテプシンL	m-カルパイン
91 (No.180)	0.16	0.050	0.069	14
94 (No.188)	0.77	1.1	0.024	9.2
109 (No.238)	4.2	1.1	1.2	13
110 (No.240)	21	3.3	0.98	6.0
120 (No.256)	56	3.9	0.49	26
135 (No.288)	59	0.31	0.054	3.2
150 (No.313)	91	1.1	0.27	5.4
159 (No.333)	0.38	0.75	1.1	1.9
160 (No.334)	35	3.3	6.6	28
162 (No.345)	0.95	5.3	—	3.7
164 (No.348)	35	6.4	3.2	1.7
165 (No.349)	9.2	7.0	1.9	13
167 (No.354)	>100	30	1.4	20
170 (No.364)	9.2	6.5	8.6	19
174 (No.382)	12	23	1.6	16
190 (No.465)	40	1.6	2.8	7.3
191 (No.479)	>100	3.5	9.3	24
197 (No.511)	13	6.0	1.7	7.8
202 (No.534)	>100	0.25	0.39	13
203 (No.536)	4.4	0.34	0.38	9.1
206 (No.543)	6.0	0.82	0.62	15
209 (No.555)	9.0	6.5	1.5	19
217 (No.600)	26	2.5	1.1	19

【0545】

【表181】

表-4 m-カルパインの阻害活性

実施例番号の化合物 (表-1の化合物番号)	IC ₅₀ (μM) m-カルパイン	実施例番号の化合物 (表-1の化合物番号)	IC ₅₀ (μM) m-カルパイン
26 (No. 57)	2.8	105 (No. 226)	1.3
29 (No. 65)	3.6	106 (No. 228)	3.1
32 (No. 73)	6.2	107 (No. 230)	4.2
47 (No. 102)	1.3	139 (No. 297)	4.5
48 (No. 104)	1.0	183 (No. 423)	9.6
55 (No. 117)	1.5	224 (No. 98)	3.4
56 (No. 118)	5.2	225 (No. 154)	1.1
57 (No. 119)	5.3	226 (No. 163)	1.8
58 (No. 120)	1.6	237 (No. 713)	1.7
59 (No. 121)	4.2	238 (No. 715)	2.7
60 (No. 122)	1.3	239 (No. 716)	0.37
61 (No. 123)	1.9	240 (No. 717)	1.4
62 (No. 124)	4.3	241 (No. 718)	3.0
63 (No. 125)	5.5	243 (No. 722)	3.1
64 (No. 126)	4.3	244 (No. 724)	1.8
65 (No. 128)	5.0	245 (No. 725)	5.0
66 (No. 130)	1.4	246 (No. 727)	3.5
67 (No. 132)	2.1	248 (No. 732)	0.28
68 (No. 135)	2.1	252 (No. 742)	0.33
69 (No. 140)	5.0	253 (No. 745)	4.7
71 (No. 142)	4.2	256 (No. 756)	5.0
77 (No. 151)	1.2	261 (No. 762)	5.8
78 (No. 103)	6.0	263 (No. 763)	0.86
79 (No. 153)	1.9	266 (No. 770)	4.1
80 (No. 155)	4.2	269 (No. 774)	4.8
81 (No. 157)	3.4	273 (No. 786)	3.3
84 (No. 165)	2.1	284 (No. 726)	3.4
85 (No. 166)	1.3	参考例3の化合物	>100
93 (No. 182)	7.8		

【0546】試験例2 可逆阻害の確認

試験例1のカルパインの阻害活性測定に準じて以下のように行った。イミダゾール緩衝液54μlに、500mMのCaCl₂溶液1μl、文献記載の合成基質の5mM溶液を4μl、10μl～150μMの阻害剤溶液1μl、m-カルパイン溶液40μlを加えて、10℃で0～20分間インキュベーションした後、100mMのEDTA溶液5μlを加えて酵素の働きを止める。次にイミダゾール緩衝液900μlを加え、さらに5mMの合成基質溶液40μl及び500mMのCaCl₂溶液10μlを加え、30℃で10分間合成基質の分解速度

を測定し、酵素の残存活性を求めた。

【0547】阻害剤としては実施例3, 113, 190の化合物を用い、また比較のため不可逆阻害剤であるE-64についても測定した。その結果を図1～図3に示す。図1～図3より、不可逆阻害剤であるE-64は、インキュベーション時間に応じてすみやかに酵素活性が消失していくのに対して、本発明の化合物は、いずれもコントロールとほぼ同等の残存活性を有している。このことから、本発明の化合物は可逆阻害剤であるといえる。

【0548】試験例3 急性毒性試験

SD雌雄ラットに本発明の化合物を0.5%CMC-Na水溶液に懸濁させたものを経口投与し、7日間症状観察を行った。実施例94の化合物のLD₅₀値は>2000mg/kgであった。

【0549】試験例4 製剤例

(1) 錠剤

下記成分を常法に従って混合し、慣用の装置により打錠した。

実施例94の化合物	30mg
結晶セルロース	60mg
コーンスターチ	100mg
乳糖	200mg
ステアリン酸マグネシウム	4mg

【0550】(2) 軟カプセル剤

下記成分を常法に従って混合し、軟カプセル剤に充填した。

実施例94の化合物	30mg
オリーブ油	300mg
レシチン	20mg

【0551】(3) 注射用製剤

下記の成分を常法に従って混合し、1mlのアンフルを調製した。

実施例106の化合物	2.5mg
------------	-------

塩化ナトリウム

3.5mg

注射用蒸留水

1ml

【0552】

【発明の効果】本発明のケトン誘導体は、パパイン、カテプシンB、カテプシンH、カテプシンL、カルパイン等のチオールプロテアーゼに対して強い阻害活性を示し、また経口吸収性、組織移行性、細胞膜透過性にもすぐれていることから、筋ジストロフィー、筋萎縮症、心筋梗塞、脳卒中、アルツハイマー病、頭部外傷時の意識障害や運動障害、多発性硬化症、末梢神経のニューロパシー、白内障、炎症、アレルギー、劇症肝炎、骨粗鬆症、高カルシウム血症、乳癌、前立腺癌、前立腺肥大等の治療薬として、あるいは癌の増殖抑制、転位予防薬、血小板の凝集阻害薬として用いることができる。

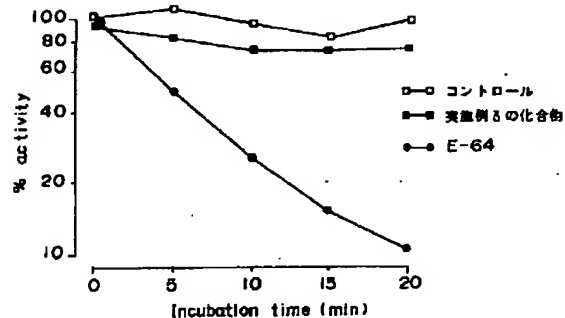
【図面の簡単な説明】

【図1】本発明化合物（実施例3の化合物）がカルパインに対して可逆的に阻害することを表した図面である。

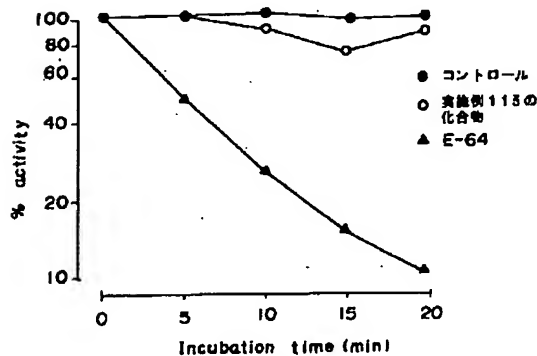
【図2】本発明化合物（実施例113の化合物）がカルパインに対して可逆的に阻害することを表した図面である。

【図3】本発明化合物（実施例190の化合物）がカルパインに対して可逆的に阻害することを表した図面である。

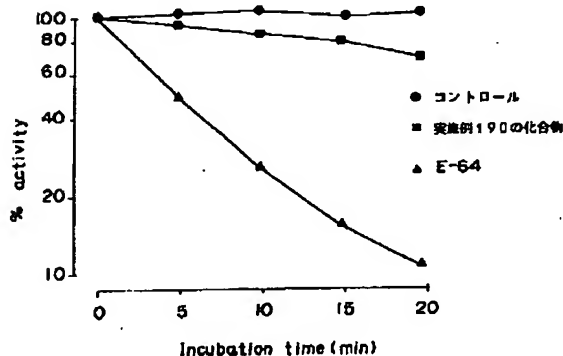
【図1】



【図2】



【図3】



フロントページの続き

(51) Int. Cl. ⁵	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 6 1 K 31/27		9283-4 C		
31/34	A B N	7431-4 C		
31/38	A A M	7431-4 C		
	A B B			
	A B E			
	A B F			
	A B J			
	A B L			
	A C B			
	A D F			
	A D N			
	A D U			
37/64		8314-4 C		
C 0 7 C 237/10		7106-4 H		
275/18		7188-4 H		
275/20		7188-4 H		
275/28		7188-4 H		
275/32		7188-4 H		
311/10		7419-4 H		
311/12		7419-4 H		
311/14		7419-4 H		
311/16		7419-4 H		
311/28		7419-4 H		
311/29		7419-4 H		
317/14		7419-4 H		
317/18		7419-4 H		
317/32		7419-4 H		
323/39		7419-4 H		
C 0 7 D 307/64				
333/34				
(72) 発明者 榊 敏郎			(72) 発明者 高橋 千寿子	
神奈川県横浜市緑区鴨志田町1000番地 三			神奈川県横浜市緑区鴨志田町1000番地 三	
菱化成株式会社総合研究所内			菱化成株式会社総合研究所内	
(72) 発明者 盛中 泰洋			(72) 発明者 玉尾 嘉邦	
神奈川県横浜市緑区鴨志田町1000番地 三			神奈川県横浜市緑区鴨志田町1000番地 三	
菱化成株式会社総合研究所内			菱化成株式会社総合研究所内	
			(72) 発明者 戸部 昭広	
			東京都千代田区丸の内二丁目5番2号 三	
			菱化成株式会社内	